



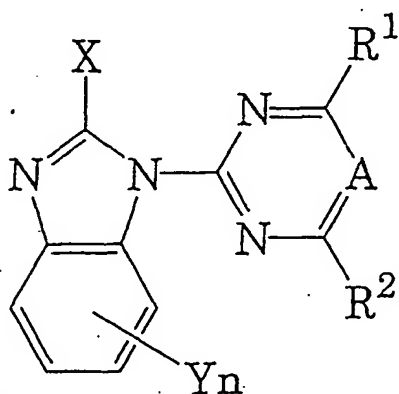
PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

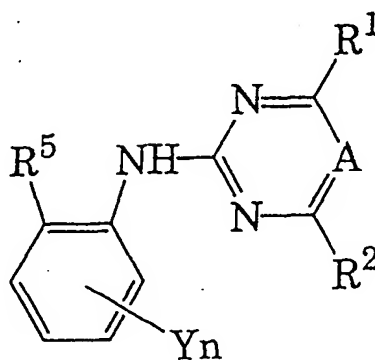
<p>(51) 国際特許分類7 C07D 403/04, 239/46, 251/42, 251/44, 251/46, A01N 43/52, 43/66</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO00/29404</p> <p>(43) 国際公開日 2000年5月25日 (25.05.00)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP99/06364</p> <p>(22) 国際出願日 1999年11月15日 (15.11.99)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平10/343614 1998年11月17日 (17.11.98) JP 特願平11/39566 1999年2月18日 (18.02.99) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) クミアイ化学工業株式会社 (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) [JP/JP] 〒110-0008 東京都台東区池之端1丁目4番26号 Tokyo, (JP) イハラケミカル工業株式会社 (IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) [JP/JP] 〒110-0008 東京都台東区池之端一丁目4番26号 Tokyo, (JP)</p> <p>(72) 発明者; および (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 柴田 卓 (SHIBATA, Masaru) [JP/JP] 河合 清 (KAWAI, Kiyoshi) [JP/JP] 牧原 丈千 (MAKIHARA, Takechi) [JP/JP] 米倉 範久 (YONEKURA, Norihisa) [JP/JP] 〒437-1213 静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1 株式会社 ケイ・アイ研究所内 Shizuoka, (JP)</p>	<p>川島隆弘 (KAWASHIMA, Takahiro) [JP/JP] 〒439-0031 静岡県小笠郡菊川町加茂1809番地 Shizuoka, (JP) 境 潤悦 (SAKAI, Junetsu) [JP/JP] 〒439-0012 静岡県小笠郡菊川町青葉台2丁目4番地9 Shizuoka, (JP) 村松憲通 (MURAMATSU, Norimichi) [JP/JP] 〒436-0088 静岡県掛川市葛ヶ丘3丁目15番地の11 Shizuoka, (JP)</p> <p>(74) 代理人 弁理士 小川利春, 外 (OGAWA, Toshiharu et al.) 〒101-0042 東京都千代田区神田東松下町38番地 鳥本鋼業ビル Tokyo, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM)</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書 補正書</p>	
<p>(54) Title: PYRIMIDINYL BENZIMIDAZOLE AND TRIAZINYL BENZIMIDAZOLE DERIVATIVES AND AGRICULTURAL/HORTICULTURAL BACTERICIDES</p> <p>(54) 発明の名称 ピリミジニルベンズイミダゾールおよびトリアジニルベンズイミダゾール誘導体及び農園芸用殺菌剤</p> <div style="text-align: center;"> <p>(I)</p> </div> <p>(57) Abstract Pyrimidinylbenzimidazole and triazinylbenzimidazole derivatives represented by general formula [I]; agricultural/horticultural bactericides containing the same as the active ingredient; and intermediates in producing the same represented by general formula [XV]. A represents N or CR³; R¹ and R² independently represent each hydrogen, halogeno, C₁₋₆ alkyl, C₂₋₆ alkenyl, etc.; R³ represents hydrogen, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkoxy or halogeno; R⁵ represents amino, nitro, etc.; X represents hydrogen, halogeno, nitro, cyano, etc.; Y represents halogeno, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, etc.; and n is 0 or an integer of 1 to 3.</p>		

(57)要約

一般式



[I]



[XV]

{式中AはN，CR³を表し、R¹及びR²は互いに独立して水素原子、ハロゲン原子、(C₁—C₆)アルキル基、(C₂—C₆)アルケニル等を、R³は水素原子、(C₁—C₆)アルキル基、(C₁—C₆)アルコキシ基、ハロゲン原子を、R⁵はアミノ基、ニトロ基等を、Xは水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基等を、Yはハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁—C₆)アルキル基等を示し、nは0又は1から3の整数を表す。}で示されるピリジニルベンズイミダゾールおよびトリアジニルベンズイミダゾール誘導体[I]、及び該誘導体を有効成分とする農園芸用殺菌剤、並びにその製造中間体[XV]である。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AE アラブ首長国連邦	DM ドミニカ	KZ カザフスタン	RU ロシア
AL アルバニア	EE エストニア	LC セントルシア	SD スーダン
AM アルメニア	ES スペイン	LI リヒテンシュタイン	SE スウェーデン
AT オーストリア	FI フィンランド	LK スリ・ランカ	SG シンガポール
AU オーストラリア	FR フランス	LR リベリア	SI スロヴェニア
AZ アゼルバイジャン	GA ガボン	LS レソト	SK スロヴァキア
BA ボスニア・ヘルツェゴビナ	GB 英国	LT リトアニア	SL シエラ・レオネ
BB バルバドス	GD グレナダ	LU ルクセンブルグ	SN セネガル
BE ベルギー	GE グルジア	LV ラトヴィア	SZ スワジランド
BF ブルキナ・ファソ	GH ガーナ	MA モロッコ	TD チャード
BG ブルガリア	GM ガンビア	MC モナコ	TG トーゴ
BJ ベナン	GN ギニア	MD モルドヴァ	TJ タジキスタン
BR ブラジル	GW ギニア・ビサウ	MG マダガスカル	TZ タンザニア
BY ベラルーシ	GR ギリシャ	MK マケドニア	TM トルクメニスタン
CA カナダ	HR クロアチア	共和国	TR トルコ
CF 中央アフリカ	HU ハンガリー	マリ	TT トリニダード・トバゴ
CG コンゴ	ID インドネシア	ML モンゴル	UA ウクライナ
CH スイス	IE アイルランド	MR モリタニア	UG ウガンダ
CI コートジボアール	IL イスラエル	MW マラウイ	US 米国
CM カメルーン	IN インド	MX メキシコ	UZ ウズベキスタン
CN 中国	IS アイスランド	NE ニジェール	VN ヴイエトナム
CR コスタ・リカ	IT イタリア	NL オランダ	YU ユーゴスラビア
CU キューバ	JP 日本	NO ノールウェー	ZA 南アフリカ共和国
CY キプロス	KE ケニア	NZ ニュー・ジーランド	ZW ジンバブエ
CZ チェッコ	KG キルギスタン	PL ポーランド	
DE ドイツ	KP 北朝鮮	PT ポルトガル	
DK デンマーク	KR 韓国	RO ルーマニア	

1

明細書

ピリミジニルベンズイミダゾールおよびトリアジニルベンズイミダゾール誘導体
及び農園芸用殺菌剤

技術分野

本発明は、新規なピリミジニルベンズイミダゾールおよびトリアジニルベンズイミダゾール誘導体及び該誘導体を有効成分とする農園芸用殺菌剤に関するものである。

技術背景

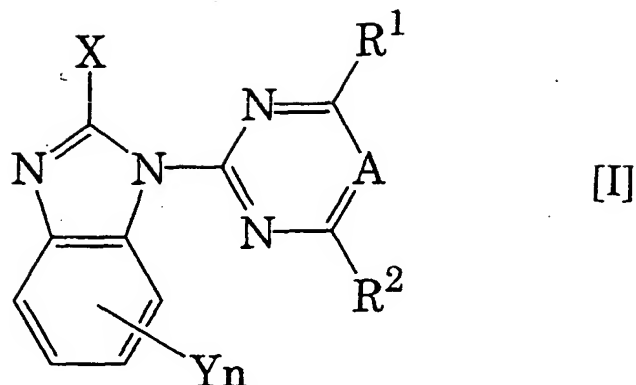
本発明化合物のピリミジニルベンズイミダゾール誘導体に関連した化合物として、米国特許第 5,525,604 号およびヨーロッパ特許第 640,599 号に医薬品として記載されている 4-アミノピリミジン誘導体が、国際公開番号 WO94/17059 号には除草剤として記載されているピリミジン誘導体があるが、いずれも農園芸用殺菌剤に関する記載は無い。フランス特許第 1,476,529 号には殺虫、殺菌活性を持つベンズイミダゾイルスルホンアミド誘導体の記載があるが、本発明化合物についての開示はない。また、本発明化合物のトリアジニルベンズイミダゾール誘導体に関連した化合物として、特開昭 47-36837 号明細書、特開昭 49-17677 号明細書および工業化学雑誌 73 巻、5 号、1000 頁(1970 年)に繊維製品の着色剤として記載されているトリアジン誘導体があるが、いずれも農園芸用殺菌剤に関する記載は無い。更に、その製造中間体であるアニリノピリミジン誘導体についても知られていない。

本発明は、新規なピリミジニルベンズイミダゾールおよびトリアジニルベンズイミダゾール誘導体及びそれを有効成分とする農園芸用殺菌剤を提供することである。

本発明者らは新規な農園芸用殺菌剤を創出すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明のピリミジニルベンズイミダゾールおよびトリアジニルベンズイミダゾール誘導体(以下、本発明化合物という)が文献未記載の新規化合物であり、且つ農園芸用殺菌剤として顕著な効果を示すことを見だし、本発明に至った。

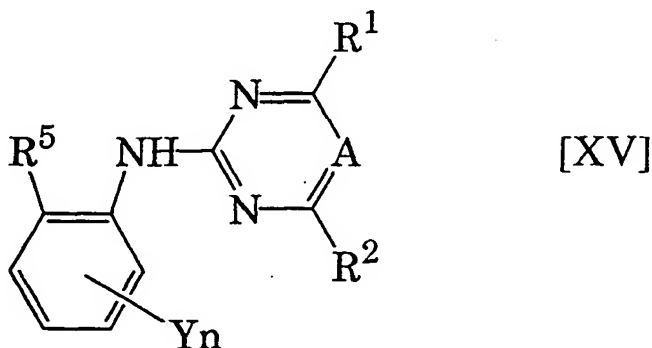
発明の開示

即ち、本発明は、一般式 [I]



(式中、A は N、CR³ を示し、R¹ および R² は互いに独立して水素原子、ハロゲン原子、(C₁–C₆)アルキル基、(C₂–C₆)アルケニル基、(C₂–C₆)アルキニル基、(C₃–C₆)シクロアルキル基、(C₁–C₄)ハロアルキル基、(C₁–C₆)アルコキシ基、(C₂–C₆)アルケニルオキシ基、(C₂–C₆)アルキニルオキシ基、(C₃–C₆)シクロアルコキシ基、(C₁–C₄)ハロアルコキシ基、シアノ(C₁–C₄)アルキルオキシ基、(C₁–C₄)アルコキシ(C₁–C₄)アルキルオキシ基、(C₃–C₆)シクロアルキル(C₁–C₄)アルコキシ基、ベンジルオキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁–C₄)アルキル基又は(C₁–C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁–C₆)アルキルチオ基、(C₁–C₆)アルコキシ(C₁–C₄)アルキル基、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁–C₄)アルキル基又は(C₁–C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁–C₄)アルキルカルボニル基、ホルミル基、フェニル基、ジ(C₁–C₄)アルキルアミノ基、シアノ基、(C₁–C₆)アルキルスルホニル基を示し、R³ は水素原子、(C₁–C₆)アルキル基、(C₁–C₆)アルコキシ基、ハロゲン原子を示し、X は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁–C₆)アルキル基、(C₂–C₆)アルケニル基、(C₂–C₆)アルキニル基、(C₃–C₆)シクロアルキル基、ベンジル基 [該基はハロゲン原子、(C₁–C₄)アルキル基又は(C₁–C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁–C₆)アルコキシ基、(C₂–C₆)アルケニルオキシ基、(C₂–C₆)アルキニルオキシ基、(C₁–C₆)アルキルチオ基、(C₁–C₆)アルキルスルホニル基、フェノキシ基、(C₁–C₄)アルコキシ(C₁–C₄)アルキル基、(C₁–C₄)ハロアルキル基、(C₁–C₄)ハロアルコキシ基、(C₁–C₄)アルキルカルボニル基、(C₁–C₄)アルコキシカルボニル基、アミノ

基、モノ(C₁–C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁–C₄)アルキルアミノ基、アニリノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁–C₄)アルキル基又は(C₁–C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、Yはハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁–C₆)アルキル基、(C₂–C₆)アルケニル基、(C₂–C₆)アルキニル基、(C₁–C₆)アルコキシ基、(C₂–C₆)アルケニルオキシ基、(C₂–C₆)アルキニルオキシ基、(C₁–C₄)ハロアルコキシ基、(C₁–C₆)アルキルチオ基、(C₁–C₄)アルコキシ(C₁–C₄)アルキル基、(C₁–C₄)ハロアルキル基、(C₁–C₄)アルキルカルボニル基、(C₁–C₄)アルコキシカルボニル基、ベンゾイル基、アミノ基、モノ(C₁–C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁–C₄)アルキルアミノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁–C₄)アルキル基又は(C₁–C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁–C₄)アルキル基又は(C₁–C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、nは0又は1から3の整数を表す。} で示されるピリミジニルベンズイミダゾールおよびトリアジニルベンズイミダゾール誘導体並びに、その中間体である式 [XV]



{式中、AはN、CR³を示し、R¹およびR²は互いに独立して水素原子、ハロゲン原子、(C₁–C₆)アルキル基、(C₂–C₆)アルケニル基、(C₂–C₆)アルキニル基、(C₃–C₆)シクロアルキル基、(C₁–C₄)ハロアルキル基、(C₁–C₆)アルコキシ基、(C₂–C₆)アルケニルオキシ基、(C₂–C₆)アルキニルオキシ基、(C₃–C₆)シクロアルコキシ基、(C₁–C₄)ハロアルコキシ基、シアノ(C₁–C₄)アルキルオキシ基、(C₁–C₄)アルコキシ(C₁–C₄)アルキルオキシ基、(C₃–C₆)シクロアルキル(C₁–C₄)アルコキ

シ基、ベンジルオキシ基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキル基、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル基、ホルミル基、フェニル基、ジ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、シアノ基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基を示し、 R^3 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロゲン原子を示し、 R^5 はアミノ基、ニトロ基、 $-NHC(=O)X$ を示し、 X は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ベンジル基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ基、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェノキシ基、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキル基、 (C_1-C_4) ハロアルキル基、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ基、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基、アミノ基、モノ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、ジ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、アニリノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]を示し、 Y はハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ基、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ基、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキル基、 (C_1-C_4) ハロアルキル基、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基、ベンゾイル基、アミノ基、モノ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、ジ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]を示し、 n は 0 又は 1 から 3 の整数を表す。] で示されるアニリノピリミジン及びアニリノトリアジン誘導体、及びピリミジニルベンズイミダゾールおよびトリアジニルベンズイミダゾール誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤である。

本明細書に記載された記号及び用語について説明する。

ハロゲン原子とはフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である。

(C₁-C₆)等の表記は、これに続く置換基の炭素数が、この場合では1~6であることを示している。

(C₁-C₆)アルキル基とは、直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を示し、例えばメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、*n*-ヘキシル、3,3-ジメチルブチル等を挙げることができる。

(C₃-C₆)シクロアルキルとは、例えばシクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル等を挙げることができる。

(C₁-C₆)ハロアルキル基とは、ハロゲン原子によって置換された、直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を示し、例えばフルオロメチル、クロロメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル等を挙げることができる。

(C₂-C₆)アルケニル基とは、直鎖又は分岐鎖状のアルケニル基を示し、例えばビニル、1-プロペニル、2-プロペニル、イソプロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル等を挙げることができる。

(C₂-C₆)アルキニル基とは、直鎖又は分岐鎖状のアルキニル基を示し、例えばエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、4-メチル-1-ペンチニル、3-メチル-1-ペンチニル等を挙げることができる。

(C₁-C₆)アルコキシ基とは、アルキル部分が前記の意味を有するアルキルオキシ基を示し、例えばメトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、イソプロポキシ、*n*-ブトキシ、イソブトキシ、*sec*-ブトキシ、*tert*-ブトキシ、*n*-ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、*n*-ヘキシルオキシ等を挙げることができる。

(C₂-C₆)アルケニルオキシ基とは、アルケニル部分が前記の意味を有するアルケニルオキシ基を示し、例えばアリルオキシ、イソプロペニルオキシ、2-ブテニルオキシ等を挙げることができる。

(C₂-C₆)アルキニルオキシ基とは、アルキニル部分が前記の意味を有するアル

6
キニルオキシ基を示し、例えば 2-プロピニルオキシ、2-ブチニルオキシ、3-ブチニルオキシ等を挙げることができる。

(C₃-C₆)シクロアルコキシ基とは、シクロアルキル部分が前記の意味を有するシクロアルキルオキシ基を示し、例えばシクロプロピルオキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ等を挙げることができる。

(C₁-C₄)ハロアルコキシ基とは、ハロアルキル部分が前記の意味を有するハロアルキルオキシ基を示し、例えばフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ペンタフルオロエトキシ等を挙げることができる。

(C₁-C₆)アルキルチオ基とは、アルキル部分が前記の意味を有するアルキルチオ基を示し、例えばメチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ、n-ヘキシルチオ等を挙げることができる。

(C₃-C₆)シクロアルキル(C₁-C₄)アルコキシ基とは、例えばシクロプロピルメチルオキシ、シクロペンチルメチルオキシ、シクロヘキシルメチルオキシ等を挙げることができる。

(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基とは、アルキル部分及びアルコキシ部分が前記の意味を有する基を示し、例えばメトキシメチル、エトキシメチル、イソプロポキシメチル、ペンチルオキシメチル、メトキシエチル、ブトキシエチル等の基を挙げることができる。

(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキルオキシ基とは、アルキル部分及びアルコキシ部分が前記の意味を有する基を示し、例えばメトキシメチルオキシ、エトキシメチルオキシ、イソプロポキシメチルオキシ、ペンチルオキシメチルオキシ、メトキシエチルオキシ、ブトキシエチルオキシ等の基を挙げることができる。

シアノ(C₁-C₄)アルキルオキシ基とは、アルキル部分が前記の意味を有する基を示し、例えばシアノメチルオキシ、シアノエチルオキシ、シアノプロピルオキシ等の基を挙げることができる。

(C₁-C₄)アルキルカルボニル基とは、アルキル部分が前記の意味を有するアルキルカルボニル基を示し、例えばアセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ピバロイル、ヘキサノイルなどの基を挙げることができる。

(C₁–C₄)アルコキシカルボニル基とは、アルコキシ部分が前記の意味を有するアルコキシカルボニル基を表し、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、*n*-プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、*n*-ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、*sec*-ブトキシカルボニル、*tert*-ブトキシカルボニル、*n*-ペンチルオキシカルボニル、*n*-ヘキシルオキシカルボニル等を挙げることができる。

モノ(C₁–C₄)アルキルアミノ基とは、アルキル部分が前記の意味を有するモノアルキルアミノ基を表し、例えばメチルアミノ、エチルアミノ、*n*-プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、*n*-ブチルアミノ、イソブチルアミノ、*sec*-ブチルアミノ、*tert*-ブチルアミノ、*n*-ヘキシルアミノ等を挙げることができる。

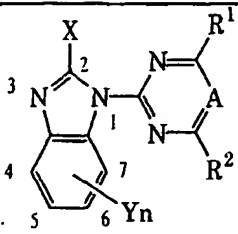
ジ(C₁–C₄)アルキルアミノ基とは、例えばジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ等を挙げることができる。

(C₁–C₆)アルキルスルホニル基とは、アルキル部分が前記の意味を有するアルキルスルホニル基を示し、例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、*n*-プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、*n*-ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、*sec*-ブチルスルホニル、*tert*-ブチルスルホニル、*n*-ヘキシルスルホニル等を挙げることができる。

次に、一般式 [I] で示される本発明化合物の具体例を表 1～表 35 に記載するが、本発明化合物はこれらの化合物に限定されるものではない。なお、化合物番号は以後の記載において参照される。

表中の記号はそれぞれ以下の意味を示す。Me とはメチルを示し、Et とはエチルを示し、Pr とは *n*-プロピルを示し、Pr-*i* とはイソプロピルを示し、Bu とは *n*-ブチルを示し、Pr-*c* とはシクロプロピルを示し、Pn-*c* とはシクロペンチルを示し、Ph とはフェニルを示し、Bn とはベンジルを示す。また、例えば Ph(2-Cl) とは 2-クロロフェニルを示し、Bn(4-Cl) とは 4-クロロベンジルを示す。

(表1)

						
化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-1	H	H	CH	OMe	OMe	167-169
I-2	Cl	H	CH	OMe	OMe	90-91
I-3	Br	H	CH	OMe	OMe	87-90
I-4	SMe	H	CH	OMe	OMe	135-137
I-5	SO ₂ Me	H	CH	OMe	OMe	114-117
I-6	Me	H	CH	OMe	OMe	132-134
I-7	Et	H	CH	OMe	OMe	102-104
I-8	Pr	H	CH	OMe	OMe	107-110
I-9	Pr-i	H	CH	OMe	OMe	70-73
I-10	Pr-c	H	CH	OMe	OMe	62-64
I-11	Bu	H	CH	OMe	OMe	
I-12	Bn	H	CH	OMe	OMe	94-96
I-13	Bn(4-Cl)	H	CH	OMe	OMe	122-125
I-14	Bn(4-Me)	H	CH	OMe	OMe	88-90
I-15	Bn(4-OMe)	H	CH	OMe	OMe	
I-16	CH=CH ₂	H	CH	OMe	OMe	
I-17	C≡CH	H	CH	OMe	OMe	
I-18	OMe	H	CH	OMe	OMe	121-122
I-19	OCH ₂ CH=CH ₂	H	CH	OMe	OMe	
I-20	OCH ₂ C≡CH	H	CH	OMe	OMe	
I-21	OCH ₂ CF ₃	H	CH	OMe	OMe	
I-22	CH ₂ OEt	H	CH	OMe	OMe	103-104
I-23	CH ₂ Cl	H	CH	OMe	OMe	132-135
I-24	CH ₂ I	H	CH	OMe	OMe	138-141
I-25	CCl ₃	H	CH	OMe	OMe	128-131
I-26	CF ₃	H	CH	OMe	OMe	79-80
I-27	C ₂ F ₅	H	CH	OMe	OMe	97-100
I-28	NH ₂	H	CH	OMe	OMe	

(表2)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-29	NHMe	H	CH	OMe	OMe	135-138
I-30	N(Me) ₂	H	CH	OMe	OMe	1.5642
I-31	NHPh	H	CH	OMe	OMe	
I-32	CO ₂ Et	H	CH	OMe	OMe	
I-33	COMe	H	CH	OMe	OMe	
I-34	Ph	H	CH	OMe	OMe	1.6219
I-35	Ph(4-Cl)	H	CH	OMe	OMe	141-144
I-36	Ph(4-Me)	H	CH	OMe	OMe	
I-37	Ph(4-OMe)	H	CH	OMe	OMe	
I-38	CN	H	CH	OMe	OMe	167-168
I-39	NO ₂	H	CH	OMe	OMe	
I-40	H	H	N	OMe	OMe	148-151
I-41	Cl	H	N	OMe	OMe	168-171
I-42	Br	H	N	OMe	OMe	
I-43	SMe	H	N	OMe	OMe	
I-44	SO ₂ Me	H	N	OMe	OMe	
I-45	Me	H	N	OMe	OMe	180-182
I-46	Et	H	N	OMe	OMe	
I-47	Pr	H	N	OMe	OMe	127-128
I-48	Pr-i	H	N	OMe	OMe	135-141
I-49	Pr-c	H	N	OMe	OMe	
I-50	Bu	H	N	OMe	OMe	
I-51	Bn	H	N	OMe	OMe	
I-52	Bn(4-Cl)	H	N	OMe	OMe	
I-53	Bn(4-Me)	H	N	OMe	OMe	
I-54	Bn(4-OMe)	H	N	OMe	OMe	
I-55	CH=CH ₂	H	N	OMe	OMe	
I-56	C≡CH	H	N	OMe	OMe	
I-57	OMe	H	N	OMe	OMe	
I-58	OCH ₂ CH=CH ₂	H	N	OMe	OMe	
I-59	OCH ₂ C≡CH	H	N	OMe	OMe	
I-60	OCH ₂ CF ₃	H	N	OMe	OMe	
I-61	OPh	H	N	OMe	OMe	
I-62	CH ₂ OEt	H	N	OMe	OMe	

(表3)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-63	CH ₂ Cl	H	N	OMe	OMe	143-146
I-64	CH ₂ I	H	N	OMe	OMe	
I-65	CCl ₃	H	N	OMe	OMe	
I-66	CF ₃	H	N	OMe	OMe	
I-67	C ₂ F ₅	H	N	OMe	OMe	
I-68	NH ₂	H	N	OMe	OMe	
I-69	NHMe	H	N	OMe	OMe	
I-70	N(Me) ₂	H	N	OMe	OMe	
I-71	NHPh	H	N	OMe	OMe	
I-72	CO ₂ Et	H	N	OMe	OMe	
I-73	COMe	H	N	OMe	OMe	261-264
I-74	Ph	H	N	OMe	OMe	
I-75	Ph(4-Cl)	H	N	OMe	OMe	
I-76	Ph(4-Me)	H	N	OMe	OMe	
I-77	Ph(4-OMe)	H	N	OMe	OMe	
I-78	CN	H	N	OMe	OMe	
I-79	NO ₂	H	N	OMe	OMe	
I-80	H	4-Me	CH	OMe	OMe	138-141
I-81	H	4-Cl	CH	OMe	OMe	
I-82	H	5-F	CH	OMe	OMe	
I-83	H	5-Cl	CH	OMe	OMe	
I-84	H	5-Br	CH	OMe	OMe	
I-85	H	5-Me	CH	OMe	OMe	
I-86	H	5-Bu-t	CH	OMe	OMe	
I-87	H	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
I-88	H	5-OMe	CH	OMe	OMe	
I-89	H	5-OEt	CH	OMe	OMe	
I-90	H	5-OPr	CH	OMe	OMe	169-171
I-91	H	5-OCF ₃	CH	OMe	OMe	
I-92	H	5-OCH ₂ CH=CH ₂	CH	OMe	OMe	
I-93	H	5-OCH ₂ C≡CH	CH	OMe	OMe	
I-94	H	5-OPh	CH	OMe	OMe	
I-95	H	5-OPh(4-Cl)	CH	OMe	OMe	
I-96	H	5-OPh(4-Me)	CH	OMe	OMe	

(表4)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-97	H	5-OPh(4-OMe)	CH	OMe	OMe	
I-98	H	5-SMe	CH	OMe	OMe	
I-99	H	5-CH ₂ OMe	CH	OMe	OMe	
I-100	H	5-COMe	CH	OMe	OMe	
I-101	H	5-COPh	CH	OMe	OMe	223-226
I-102	H	5-CO ₂ Et	CH	OMe	OMe	185-188
I-103	H	5-Ph	CH	OMe	OMe	162-165
I-104	H	5-Ph(4-Cl)	CH	OMe	OMe	
I-105	H	5-Ph(4-Me)	CH	OMe	OMe	
I-106	H	5-Ph(4-OMe)	CH	OMe	OMe	
I-107	H	5-NO ₂	CH	OMe	OMe	
I-108	H	5-NH ₂	CH	OMe	OMe	
I-109	H	5-NHMe	CH	OMe	OMe	
I-110	H	5-N(Me) ₂	CH	OMe	OMe	
I-111	H	5-CN	CH	OMe	OMe	249-252
I-112	H	6-F	CH	OMe	OMe	192-193
I-113	H	6-Cl	CH	OMe	OMe	199-202
I-114	H	6-Me	CH	OMe	OMe	134-136
I-115	H	6-CF ₃	CH	OMe	OMe	192-193
I-116	H	6-OMe	CH	OMe	OMe	184-185
I-117	H	6-CO ₂ Et	CH	OMe	OMe	184-187
I-118	H	6-COPh	CH	OMe	OMe	176-179
I-119	H	7-Me	CH	OMe	OMe	134-137
I-120	H	7-Cl	CH	OMe	OMe	
I-121	H	5,6-Cl ₂	CH	OMe	OMe	217-220
I-122	H	5,6-(Me) ₂	CH	OMe	OMe	185-187
I-123	H	5,6-(OMe) ₂	CH	OMe	OMe	
I-124	H	4-Br,6-CF ₃	CH	OMe	OMe	188-191
I-125	H	4-Cl,6-CF ₃	CH	OMe	OMe	204-206
I-126	H	4,5,6-F ₃	CH	OMe	OMe	
I-127	H	4-Me	N	OMe	OMe	
I-128	H	4-Cl	N	OMe	OMe	
I-129	H	5-F	N	OMe	OMe	
I-130	H	5-Cl	N	OMe	OMe	175-178

(表5)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-131	H	5-Br	N	OMe	OMe	> 300
I-132	H	5-I	N	OMe	OMe	145-148
I-133	H	5-Me	N	OMe	OMe	177-180
I-134	H	5-Et	N	OMe	OMe	120-123
I-135	H	5-Pr	N	OMe	OMe	101-104
I-136	H	5-Pr-i	N	OMe	OMe	87-90
I-137	H	5-Bu-t	N	OMe	OMe	146-147
I-138	H	5-CH=CH ₂	N	OMe	OMe	
I-139	H	5-C≡CBu	N	OMe	OMe	
I-140	H	5-CF ₃	N	OMe	OMe	
I-141	H	5-OMe	N	OMe	OMe	164-167
I-142	H	5-OEt	N	OMe	OMe	
I-143	H	5-OPr	N	OMe	OMe	
I-144	H	5-OCF ₃	N	OMe	OMe	
I-145	H	5-OCH ₂ CH=CH ₂	N	OMe	OMe	
I-146	H	5-OCH ₂ C≡CH	N	OMe	OMe	
I-147	H	5-OPh	N	OMe	OMe	
I-148	H	5-OPh(4-Cl)	N	OMe	OMe	
I-149	H	5-OPh(4-Me)	N	OMe	OMe	
I-150	H	5-OPh(4-OMe)	N	OMe	OMe	
I-151	H	5-SMe	N	OMe	OMe	
I-152	H	5-CH ₂ OMe	N	OMe	OMe	
I-153	H	5-COMe	N	OMe	OMe	
I-154	H	5-COPh	N	OMe	OMe	
I-155	H	5-CO ₂ Et	N	OMe	OMe	
I-156	H	5-Ph	N	OMe	OMe	
I-157	H	5-Ph(4-Cl)	N	OMe	OMe	
I-158	H	5-Ph(4-Me)	N	OMe	OMe	
I-159	H	5-Ph(4-OMe)	N	OMe	OMe	
I-160	H	5-NO ₂	N	OMe	OMe	210-213
I-161	H	5-NH ₂	N	OMe	OMe	
I-162	H	5-NHMe	N	OMe	OMe	
I-163	H	5-N(Me) ₂	N	OMe	OMe	
I-164	H	5-CN	N	OMe	OMe	

(表6)

13

(表6)

化合物 番号	X	Yn	A	R ⁱ	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-165	H	6-F	N	OMe	OMe	> 300
I-166	H	6-Cl	N	OMe	OMe	
I-167	H	6-Me	N	OMe	OMe	
I-168	H	6-CF ₃	N	OMe	OMe	
I-169	H	6-OMe	N	OMe	OMe	
I-170	H	6-NO ₂	N	OMe	OMe	
I-171	H	6-CO ₂ Et	N	OMe	OMe	
I-172	H	6-COPh	N	OMe	OMe	
I-173	H	7-Me	N	OMe	OMe	
I-174	H	7-Cl	N	OMe	OMe	
I-175	H	5,6-Cl ₂	N	OMe	OMe	176-179
I-176	H	5,6-(Me) ₂	N	OMe	OMe	193-196
I-177	H	5,6-(OMe) ₂	N	OMe	OMe	
I-178	H	4-Br,6-CF ₃	N	OMe	OMe	
I-179	H	4-Cl,6-CF ₃	N	OMe	OMe	
I-180	H	4,5,6-F ₃	N	OMe	OMe	
I-181	Me	4-Me	CH	OMe	OMe	127-130
I-182	Me	4-Cl	CH	OMe	OMe	
I-183	Me	5-F	CH	OMe	OMe	163-165
I-184	Me	5-Cl	CH	OMe	OMe	153-156
I-185	Me	5-Br	CH	OMe	OMe	180-183
I-186	Me	5-Me	CH	OMe	OMe	163-166
I-187	Me	5-Bu-t	CH	OMe	OMe	126-129
I-188	Me	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	129-132
I-189	Me	5-OMe	CH	OMe	OMe	190-193
I-190	Me	5-OEt	CH	OMe	OMe	211-214
I-191	Me	5-OPr	CH	OMe	OMe	
I-192	Me	5-OCF ₃	CH	OMe	OMe	137-139
I-193	Me	5-OPh	CH	OMe	OMe	
I-194	Me	5-CO ₂ Et	CH	OMe	OMe	173-176
I-195	Me	5-COPh	CH	OMe	OMe	169-171
I-196	Me	5-Ph	CH	OMe	OMe	164-166
I-197	Me	5-NH ₂	CH	OMe	OMe	
I-198	Me	5-N(Me) ₂	CH	OMe	OMe	

(表7)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-199	Me	5-CN	CH	OMe	OMe	211-214
I-200	Me	6-F	CH	OMe	OMe	162-163
I-201	Me	6-Cl	CH	OMe	OMe	165-166
I-202	Me	6-Me	CH	OMe	OMe	128-131
I-203	Me	6-CF ₃	CH	OMe	OMe	162-165
I-204	Me	6-OMe	CH	OMe	OMe	158-161
I-205	Me	6-OEt	CH	OMe	OMe	
I-206	Me	6-OPr	CH	OMe	OMe	
I-207	Me	6-CO ₂ Et	CH	OMe	OMe	184-187
I-208	Me	6-COPh	CH	OMe	OMe	179-182
I-209	Me	5,6-Cl ₂	CH	OMe	OMe	204-206
I-210	Me	5,6-(Me) ₂	CH	OMe	OMe	169-172
I-211	Me	5,6-(OMe) ₂	CH	OMe	OMe	
I-212	Me	4-Me	N	OMe	OMe	180-182
I-213	Me	4-Cl	N	OMe	OMe	
I-214	Me	5-F	N	OMe	OMe	185-188
I-215	Me	5-Cl	N	OMe	OMe	173-176
I-216	Me	5-Br	N	OMe	OMe	> 300
I-217	Me	5-I	N	OMe	OMe	161-164
I-218	Me	5-Me	N	OMe	OMe	192-195
I-219	Me	5-Et	N	OMe	OMe	113-116
I-220	Me	5-Pr	N	OMe	OMe	128-131
I-221	Me	5-Pr-i	N	OMe	OMe	124-125
I-222	Me	5-Bu-t	N	OMe	OMe	143-144
I-223	Me	5-CH=CH ₂	N	OMe	OMe	
I-224	Me	5-C≡CBu	N	OMe	OMe	111-114
I-225	Me	5-CF ₃	N	OMe	OMe	167-170
I-226	Me	5-OMe	N	OMe	OMe	161-164
I-227	Me	5-OEt	N	OMe	OMe	
I-228	Me	5-OPr	N	OMe	OMe	
I-229	Me	5-OCF ₃	N	OMe	OMe	128-131
I-230	Me	5-OPh	N	OMe	OMe	
I-231	Me	5-SMe	N	OMe	OMe	
I-232	Me	5-CO ₂ Me	N	OMe	OMe	148-151

(表8)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-233	Me	5-CO ₂ Et	N	OMe	OMe	155-158 163-166
I-234	Me	5-COMe	N	OMe'	OMe	
I-235	Me	5-COPh	N	OMe	OMe	
I-236	Me	5-Ph	N	OMe	OMe	
I-237	Me	5-NH ₂	N	OMe	OMe	
I-238	Me	5-N(Me) ₂	N	OMe	OMe	188-191 130-133
I-239	Me	5-CN	N	OMe	OMe	
I-240	Me	6-F	N	OMe	OMe	
I-241	Me	6-Cl	N	OMe	OMe	
I-242	Me	6-Me	N	OMe	OMe	
I-243	Me	6-CF ₃	N	OMe	OMe	172-175 165-168
I-244	Me	6-OMe	N	OMe	OMe	
I-245	Me	6-OEt	N	OMe	OMe	
I-246	Me	6-OPr	N	OMe	OMe	
I-247	Me	6-CO ₂ Et	N	OMe	OMe	
I-248	Me	6-COPh	N	OMe	OMe	145-148 136-139
I-249	Me	5,6-Cl ₂	N	OMe	OMe	
I-250	Me	4,6-(Me) ₂	N	OMe	OMe	
I-251	Me	5,6-(Me) ₂	N	OMe	OMe	
I-252	Me	5,6-(OMe) ₂	N	OMe	OMe	
I-253	Cl	4-Me	CH	OMe	OMe	148-150 187-190
I-254	Cl	4-Cl	CH	OMe	OMe	
I-255	Cl	5-F	CH	OMe	OMe	
I-256	Cl	5-Cl	CH	OMe	OMe	
I-257	Cl	5-Br	CH	OMe	OMe	
I-258	Cl	5-Me	CH	OMe	OMe	102-105
I-259	Cl	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
I-260	Cl	5-OMe	CH	OMe	OMe	
I-261	Cl	5-OEt	CH	OMe	OMe	
I-262	Cl	5-OPr	CH	OMe	OMe	
I-263	Cl	5-OCF ₃	CH	OMe	OMe	102-105
I-264	Cl	5-OPh	CH	OMe	OMe	
I-265	Cl	5-COPh	CH	OMe	OMe	
I-266	Cl	5-Ph	CH	OMe	OMe	

(表9)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-267	Cl	5-NH ₂	CH	OMe	OMe	163-164 98-101
I-268	Cl	5-N(Me) ₂	CH	OMe	OMe	
I-269	Cl	5-CN	CH	OMe	OMe	
I-270	Cl	6-F	CH	OMe	OMe	
I-271	Cl	6-Cl	CH	OMe	OMe	
I-272	Cl	6-Me	CH	OMe	OMe	
I-273	Cl	5,6-(OMe) ₂	CH	OMe	OMe	
I-274	Cl	4-Me	N	OMe	OMe	
I-275	Cl	4-Cl	N	OMe	OMe	
I-276	Cl	5-F	N	OMe	OMe	
I-277	Cl	5-Cl	N	OMe	OMe	146-149
I-278	Cl	5-Br	N	OMe	OMe	159-162
I-279	Cl	5-Me	N	OMe	OMe	
I-280	Cl	5-CF ₃	N	OMe	OMe	
I-281	Cl	5-OMe	N	OMe	OMe	
I-282	Cl	5-OEt	N	OMe	OMe	
I-283	Cl	5-OPr	N	OMe	OMe	
I-284	Cl	5-OCF ₃	N	OMe	OMe	
I-285	Cl	5-OPh	N	OMe	OMe	
I-286	Cl	5-COPh	N	OMe	OMe	
I-287	Cl	5-Ph	N	OMe	OMe	133-136 114-116
I-288	Cl	5-NH ₂	N	OMe	OMe	
I-289	Cl	5-N(Me) ₂	N	OMe	OMe	
I-290	Cl	5-CN	N	OMe	OMe	
I-291	Cl	6-F	N	OMe	OMe	
I-292	Cl	6-Cl	N	OMe	OMe	
I-293	Cl	6-Me	N	OMe	OMe	
I-294	Cl	5,6-(OMe) ₂	N	OMe	OMe	
I-295	CF ₃	5-F	CH	OMe	OMe	
I-296	CF ₃	5-Cl	CH	OMe	OMe	93-96 78-79 129-132
I-297	CF ₃	5-Br	CH	OMe	OMe	
I-298	CF ₃	5-Me	CH	OMe	OMe	
I-299	CF ₃	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
I-300	CF ₃	5-OMe	CH	OMe	OMe	

(表10)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-301	CF ₃	5-OEt	CH	OMe	OMe	151-154
I-302	CF ₃	5-OPr	CH	OMe	OMe	
I-303	CF ₃	5-N(Me) ₂	CH	OMe	OMe	
I-304	CF ₃	5-CN	CH	OMe	OMe	
I-305	CF ₃	6-F	CH	OMe	OMe	
I-306	CF ₃	6-Cl	CH	OMe	OMe	
I-307	CF ₃	6-Me	CH	OMe	OMe	132-135
I-308	CF ₃	5,6-(OMe) ₂	CH	OMe	OMe	
I-309	CF ₃	5-F	N	OMe	OMe	170-173
I-310	CF ₃	5-Cl	N	OMe	OMe	135-138
I-311	CF ₃	5-Br	N	OMe	OMe	111-114
I-312	CF ₃	5-Me	N	OMe	OMe	137-140
I-313	CF ₃	5-Et	N	OMe	OMe	104-107
I-314	CF ₃	5-Pr	N	OMe	OMe	89-92
I-315	CF ₃	5-Pr-i	N	OMe	OMe	118-121
I-316	CF ₃	5-Bu-t	N	OMe	OMe	113-116
I-317	CF ₃	5-CF ₃	N	OMe	OMe	
I-318	CF ₃	5-OMe	N	OMe	OMe	165-168
I-319	CF ₃	5-OEt	N	OMe	OMe	
I-320	CF ₃	5-OPr	N	OMe	OMe	
I-321	CF ₃	5-OCF ₃	N	OMe	OMe	187-190
I-322	CF ₃	5-SMe	N	OMe	OMe	
I-323	CF ₃	5-NHMe	N	OMe	OMe	
I-324	CF ₃	5-N(Me) ₂	N	OMe	OMe	
I-325	CF ₃	5-CN	N	OMe	OMe	188-191
I-326	CF ₃	5-CO ₂ Me	N	OMe	OMe	126-129
I-327	CF ₃	5-I	N	OMe	OMe	115-118
I-328	CF ₃	6-F	N	OMe	OMe	
I-329	CF ₃	6-Cl	N	OMe	OMe	
I-330	CF ₃	6-Me	N	OMe	OMe	
I-331	CF ₃	5,6-(OMe) ₂	N	OMe	OMe	
I-332	Et	5-F	CH	OMe	OMe	135-138
I-333	Et	5-Cl	CH	OMe	OMe	137-140
I-334	Et	5-Me	CH	OMe	OMe	120-122

(表11)

化合物 番号	X	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-335	Et	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	117-118
I-336	Et	5-OMe	CH	OMe	OMe	118-120
I-337	Et	5-OEt	CH	OMe	OMe	
I-338	Et	5-OPr	CH	OMe	OMe	
I-339	Et	5-N(Me) ₂	CH	OMe	OMe	
I-340	Et	5-CN	CH	OMe	OMe	
I-341	Et	6-F	CH	OMe	OMe	
I-342	Et	6-Cl	CH	OMe	OMe	
I-343	Et	6-Me	CH	OMe	OMe	
I-344	Et	5,6-(OMe) ₂	CH	OMe	OMe	
I-345	Et	5-F	N	OMe	OMe	
I-346	Et	5-Cl	N	OMe	OMe	125-128
I-347	Et	5-Me	N	OMe	OMe	
I-348	Et	5-CF ₃	N	OMe	OMe	
I-349	Et	5-OMe	N	OMe	OMe	
I-350	Et	5-OEt	N	OMe	OMe	
I-351	Et	5-OPr	N	OMe	OMe	
I-352	Et	5-N(Me) ₂	N	OMe	OMe	
I-353	Et	5-CN	N	OMe	OMe	
I-354	Et	6-F	N	OMe	OMe	
I-355	Et	6-Cl	N	OMe	OMe	
I-356	Et	6-Me	N	OMe	OMe	
I-357	Et	5,6-(OMe) ₂	N	OMe	OMe	
I-358	Pr	5-Cl	N	OMe	OMe	128-131
I-359	Pr-i	5-Cl	N	OMe	OMe	160-163
I-360	Pr-c	5-Cl	N	OMe	OMe	146-149
I-361	NH ₂	5-F	CH	OMe	OMe	236-239
I-362	NH ₂	5-Me	CH	OMe	OMe	>300
I-363	NH ₂	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	268-271
I-364	NH ₂	5-OMe	CH	OMe	OMe	232-235
I-365	NH ₂	5-OEt	CH	OMe	OMe	239-242
I-366	NH ₂	6-Me	CH	OMe	OMe	>300
I-367	NH ₂	5,6-(OMe) ₂	CH	OMe	OMe	
I-368	NH ₂	5-Cl	N	OMe	OMe	293-296

(表12)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-369	NH ₂	5-Me	N	OMe	OMe	272-275
I-370	NH ₂	5-CF ₃	N	OMe	OMe	
I-371	NH ₂	5-OMe	N	OMe	OMe	
I-372	NH ₂	5-OEt	N	OMe	OMe	
I-373	NH ₂	6-Me	N	OMe	OMe	
I-374	NH ₂	5,6-(OMe) ₂	N	OMe	OMe	
I-375	NHMe	5-Cl	N	OMe	OMe	238-241
I-376	N(Me) ₂	5-Cl	N	OMe	OMe	66-69
I-377	CH ₂ OMe	5-Cl	N	OMe	OMe	105-108
I-378	Ph	5-Cl	N	OMe	OMe	137-140
I-379	Bn	5-Cl	N	OMe	OMe	192-195
I-380	CN	5-Cl	CH	OMe	OMe	223-226
I-381	CN	5-Me	CH	OMe	OMe	229-231
I-382	CN	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
I-383	CN	5-OMe	CH	OMe	OMe	
I-384	CN	5-Cl	N	OMe	OMe	
I-385	CN	5-Me	N	OMe	OMe	
I-386	CN	5-CF ₃	N	OMe	OMe	
I-387	CN	5-OMe	N	OMe	OMe	
I-388	SMe	5-Cl	CH	OMe	OMe	184-187
I-389	SMe	5-Me	CH	OMe	OMe	155-158
I-390	SMe	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
I-391	SMe	5-OMe	CH	OMe	OMe	
I-392	SMe	6-Cl	CH	OMe	OMe	
I-393	SMe	6-Me	CH	OMe	OMe	
I-394	SMe	5-Cl	N	OMe	OMe	135-138
I-395	SMe	5-Me	N	OMe	OMe	
I-396	SMe	5-CF ₃	N	OMe	OMe	
I-397	SMe	5-OMe	N	OMe	OMe	
I-398	SMe	6-Cl	N	OMe	OMe	
I-399	SMe	6-Me	N	OMe	OMe	
I-400	CCl ₃	5-Cl	CH	OMe	OMe	132-134
I-401	CCl ₃	5-Me	CH	OMe	OMe	
I-402	CCl ₃	5-OMe	CH	OMe	OMe	

(表13)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-403	CCl ₃	6-Cl	CH	OMe	OMe	136-139
I-404	CCl ₃	6-Me	CH	OMe	OMe	
I-405	CCl ₃	5-Cl	N	OMe	OMe	
I-406	CCl ₃	5-Me	N	OMe	OMe	
I-407	CCl ₃	5-OMe	N	OMe	OMe	
I-408	CCl ₃	5-Br	N	OMe	OMe	
I-409	CCl ₃	6-Cl	N	OMe	OMe	
I-410	CCl ₃	6-Me	N	OMe	OMe	
I-411	CF ₂ Cl	5-Me	N	OMe	OMe	
I-412	CF ₂ Cl	5-Cl	N	OMe	OMe	109-111
I-413	CF ₂ Cl	5-Br	N	OMe	OMe	
I-414	CF ₂ Cl	5-OMe	N	OMe	OMe	
I-415	CH ₂ Cl	5-Me	N	OMe	OMe	
I-416	CH ₂ Cl	5-Cl	N	OMe	OMe	
I-417	CH ₂ Cl	5-Br	N	OMe	OMe	
I-418	CH ₂ Cl	5-OMe	N	OMe	OMe	
I-419	C ₂ F ₅	5-Me	N	OMe	OMe	
I-420	C ₂ F ₅	5-Cl	N	OMe	OMe	
I-421	C ₂ F ₅	5-Br	N	OMe	OMe	86-89
I-422	C ₂ F ₅	5-OMe	N	OMe	OMe	
I-423	SO ₂ Me	5-Cl	CH	OMe	OMe	
I-424	SO ₂ Me	5-Me	CH	OMe	OMe	
I-425	SO ₂ Me	6-Me	CH	OMe	OMe	
I-426	SO ₂ Me	5-Cl	N	OMe	OMe	
I-427	SO ₂ Me	5-Me	N	OMe	OMe	
I-428	SO ₂ Me	6-Me	N	OMe	OMe	
I-429	OMe	5-Cl	CH	OMe	OMe	
I-430	OMe	6-Cl	CH	OMe	OMe	149-152
I-431	OMe	5-Cl	N	OMe	OMe	
I-432	OMe	6-Cl	N	OMe	OMe	
I-433	H	H	N	OMe	OEt	
I-434	H	5-Cl	N	OMe	OEt	
I-435	H	5-Br	N	OMe	OEt	
I-436	H	5-Me	N	OMe	OEt	
I-437						176-177
I-438						
I-439						
I-440						
I-441						
I-442						
I-443						
I-444						
I-445						
I-446						
I-447						182-185
I-448						
I-449						
I-450						
I-451						
I-452						
I-453						
I-454						
I-455						
I-456						
I-457						178-180
I-458						
I-459						
I-460						
I-461						
I-462						
I-463						
I-464						
I-465						
I-466						
I-467						194-196
I-468						
I-469						
I-470						
I-471						
I-472						
I-473						
I-474						
I-475						
I-476						

(表14)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-437	Me	H	N	OMe	OEt	
I-438	Me	5-Cl	N	OMe	OEt	153-156
I-439	Me	5-Br	N	OMe	OEt	143-145
I-440	Me	5-Me	N	OMe	OEt	155-156
I-441	Cl	5-Cl	N	OMe	OEt	
I-442	Cl	5-Br	N	OMe	OEt	
I-443	Cl	5-Me	N	OMe	OEt	
I-444	CF ₃	H	N	OMe	OEt	
I-445	CF ₃	5-Me	N	OMe	OEt	147-150
I-446	CF ₃	5-Cl	N	OMe	OEt	149-151
I-447	CF ₃	5-Br	N	OMe	OEt	138-139
I-448	CF ₂ Cl	5-Cl	N	OMe	OEt	
I-449	CF ₂ Cl	5-Br	N	OMe	OEt	
I-450	CF ₂ Cl	5-Me	N	OMe	OEt	
I-451	CH ₂ Cl	5-Cl	N	OMe	OEt	
I-452	CH ₂ Cl	5-Br	N	OMe	OEt	
I-453	CH ₂ Cl	5-Me	N	OMe	OEt	
I-454	C ₂ F ₅	5-Cl	N	OMe	OEt	
I-455	C ₂ F ₅	5-Br	N	OMe	OEt	
I-456	C ₂ F ₅	5-Me	N	OMe	OEt	
I-457	H	H	CH	OEt	OEt	122-124
I-458	Cl	H	CH	OEt	OEt	79-82
I-459	Br	H	CH	OEt	OEt	
I-460	SMe	H	CH	OEt	OEt	122-125
I-461	Me	H	CH	OEt	OEt	88-91
I-462	Et	H	CH	OEt	OEt	90-93
I-463	OMe	H	CH	OEt	OEt	87-89
I-464	OEt	H	CH	OEt	OEt	96-99
I-465	CF ₃	H	CH	OEt	OEt	90-92
I-466	NH ₂	H	CH	OEt	OEt	222-225
I-467	CN	H	CH	OEt	OEt	153-156
I-468	H	H	N	OEt	OEt	
I-469	Cl	H	N	OEt	OEt	
I-470	Br	H	N	OEt	OEt	

(表15)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-471	SMe	H	N	OEt	OEt	
I-472	Me	H	N	OEt	OEt	
I-473	Et	H	N	OEt	OEt	
I-474	OMe	H	N	OEt	OEt	
I-475	OEt	H	N	OEt	OEt	
I-476	CF ₃	H	N	OEt	OEt	
I-477	NH ₂	H	N	OEt	OEt	
I-478	CN	H	N	OEt	OEt	
I-479	H	5-F	CH	OEt	OEt	156-159
I-480	H	5-Cl	CH	OEt	OEt	177-180
I-481	H	5-Br	CH	OEt	OEt	
I-482	H	5-Me	CH	OEt	OEt	135-138
I-483	H	5-CF ₃	CH	OEt	OEt	165-168
I-484	H	5-OMe	CH	OEt	OEt	
I-485	H	5-OEt	CH	OEt	OEt	
I-486	H	6-Cl	CH	OEt	OEt	164-167
I-487	H	5,6-(OMe) ₂	CH	OEt	OEt	
I-488	H	5-F	N	OEt	OEt	
I-489	H	5-Cl	N	OEt	OEt	
I-490	H	5-Br	N	OEt	OEt	170-173
I-491	H	5-Me	N	OEt	OEt	
I-492	H	5-Bu-t	N	OEt	OEt	107-110
I-493	H	5-CF ₃	N	OEt	OEt	
I-494	H	5-OMe	N	OEt	OEt	
I-495	H	5-OEt	N	OEt	OEt	
I-496	H	6-Cl	N	OEt	OEt	
I-497	H	5,6-(OMe) ₂	N	OEt	OEt	
I-498	Me	5-F	CH	OEt	OEt	131-133
I-499	Me	5-Cl	CH	OEt	OEt	171-174
I-500	Me	5-Br	CH	OEt	OEt	
I-501	Me	5-Me	CH	OEt	OEt	119-122
I-502	Me	5-CF ₃	CH	OEt	OEt	131-134
I-503	Me	5-OMe	CH	OEt	OEt	141-144
I-504	Me	5-OEt	CH	OEt	OEt	

(表16)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(°C) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-505	Me	5-OCF ₃	CH	OEt	OEt	133-134 146-149 138-141 135-138
I-506	Me	5-CN	CH	OEt	OEt	
I-507	Me	6-F	CH	OEt	OEt	
I-508	Me	6-Cl	CH	OEt	OEt	
I-509	Me	6-Me	CH	OEt	OEt	
I-510	Me	6-CF ₃	CH	OEt	OEt	
I-511	Me	6-OMe	CH	OEt	OEt	
I-512	Me	5,6-(OMe) ₂	CH	OEt	OEt	
I-513	Me	5-F	N	OEt	OEt	
I-514	Me	5-Cl	N	OEt	OEt	
I-515	Me	5-Br	N	OEt	OEt	175-178
I-516	Me	5-Me	N	OEt	OEt	169-172
I-517	Me	5-Bu-t	N	OEt	OEt	141-144
I-518	Me	5-CF ₃	N	OEt	OEt	107-109
I-519	Me	5-OMe	N	OEt	OEt	
I-520	Me	5-OEt	N	OEt	OEt	
I-521	Me	5-OCF ₃	N	OEt	OEt	
I-522	Me	5-CN	N	OEt	OEt	
I-523	Me	6-F	N	OEt	OEt	
I-524	Me	6-Cl	N	OEt	OEt	
I-525	Me	6-Me	N	OEt	OEt	
I-526	Me	6-CF ₃	N	OEt	OEt	
I-527	Me	6-OMe	N	OEt	OEt	
I-528	Me	5,6-(OMe) ₂	N	OEt	OEt	
I-529	Cl	5-Cl	CH	OEt	OEt	101-103 153-156
I-530	Cl	5-Me	CH	OEt	OEt	
I-531	Cl	5-OMe	CH	OEt	OEt	
I-532	Cl	5-OEt	CH	OEt	OEt	
I-533	Cl	5,6-(OMe) ₂	CH	OEt	OEt	
I-534	Cl	5-Cl	N	OEt	OEt	130-133
I-535	Cl	5-Me	N	OEt	OEt	
I-536	Cl	5-OMe	N	OEt	OEt	
I-537	Cl	5-OEt	N	OEt	OEt	
I-538	Cl	5,6-(OMe) ₂	N	OEt	OEt	

(表17)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-539	CF ₃	5-Me	CH	OEt	OEt	163-165
I-540	CF ₃	5-OMe	CH	OEt	OEt	
I-541	CF ₃	5,6-(OMe) ₂	CH	OEt	OEt	
I-542	CF ₃	H	N	OEt	OEt	
I-543	CF ₃	5-Me	N	OEt	OEt	
I-544	CF ₃	5-OMe	N	OEt	OEt	
I-545	CF ₃	5-Cl	N	OEt	OEt	
I-546	CF ₃	5-Br	N	OEt	OEt	
I-547	Et	5-Me	CH	OEt	OEt	
I-548	Et	5-OMe	CH	OEt	OEt	
I-549	Et	5,6-(OMe) ₂	CH	OEt	OEt	140-143
I-550	CCl ₃	5-Cl	N	OEt	OEt	
I-551	CCl ₃	5-Br	N	OEt	OEt	
I-552	CCl ₃	5-Me	N	OEt	OEt	
I-553	CCl ₃	5-OMe	N	OEt	OEt	
I-554	CF ₂ Cl	5-Cl	N	OEt	OEt	
I-555	CF ₂ Cl	5-Br	N	OEt	OEt	
I-556	CF ₂ Cl	5-Me	N	OEt	OEt	
I-557	CH ₂ Cl	5-Cl	N	OEt	OEt	
I-558	CH ₂ Cl	5-Br	N	OEt	OEt	
I-559	CH ₂ Cl	5-Me	N	OEt	OEt	110-113
I-560	C ₂ F ₅	5-Cl	N	OEt	OEt	
I-561	C ₂ F ₅	5-Br	N	OEt	OEt	
I-562	C ₂ F ₅	5-Me	N	OEt	OEt	
I-563	CN	5-Cl	CH	OEt	OEt	
I-564	CN	5-OMe	CH	OEt	OEt	
I-565	CN	5,6-(OMe) ₂	CH	OEt	OEt	
I-566	CN	5-Me	N	OEt	OEt	
I-567	CN	5-OMe	N	OEt	OEt	
I-568	CN	5-Cl	N	OEt	OEt	
I-569	SMe	5-Cl	CH	OEt	OEt	170-172
I-570	SMe	5-Me	CH	OEt	OEt	
I-571	SMe	5-Cl	N	OEt	OEt	
I-572	SMe	5-Me	N	OEt	OEt	
						167-169

(表18)

化合物 番号	X	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-573	SO ₂ Me	5-Cl	CH	OEt	OEt	167-170
I-574	SO ₂ Me	5-Me	CH	OEt	OEt	
I-575	OMe	5-Cl	CH	OEt	OEt	143-146
I-576	H	H	CH	OPr	OPr	89-90
I-577	H	H	N	OPr	OPr	
I-578	H	5-Cl	N	OPr	OPr	
I-579	H	5-Br	N	OPr	OPr	
I-580	Me	5-Cl	N	OPr	OPr	128-131
I-581	Me	5-Br	N	OPr	OPr	
I-582	Me	5-Me	N	OPr	OPr	
I-583	CF ₃	5-Cl	N	OPr	OPr	71-74
I-584	CF ₃	5-Br	N	OPr	OPr	
I-585	CF ₃	5-Me	N	OPr	OPr	
I-586	H	H	CH	OPr-i	OPr-i	115-117
I-587	Me	5-Cl	CH	OPr-i	OPr-i	
I-588	Me	5-Me	CH	OPr-i	OPr-i	
I-589	H	H	N	OPr-i	OPr-i	
I-590	H	5-Cl	N	OPr-i	OPr-i	
I-591	H	5-Br	N	OPr-i	OPr-i	
I-592	Me	5-Cl	N	OPr-i	OPr-i	85-88
I-593	Me	5-Br	N	OPr-i	OPr-i	
I-594	Me	5-Me	N	OPr-i	OPr-i	
I-595	CF ₃	5-Cl	N	OPr-i	OPr-i	97-100
I-596	CF ₃	5-Br	N	OPr-i	OPr-i	
I-597	CF ₃	5-Me	N	OPr-i	OPr-i	
I-598	H	H	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
I-599	H	5-Cl	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
I-600	H	5-Br	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
I-601	Me	5-Cl	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	158-161
I-602	Me	5-Br	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
I-603	Me	5-Me	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
I-604	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
I-605	CF ₃	5-Br	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
I-606	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	

(表19)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-607	H	H	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
I-608	H	5-Cl	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
I-609	H	5-Br	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
I-610	Me	5-Cl	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
I-611	Me	5-Br	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
I-612	Me	5-Me	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
I-613	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
I-614	CF ₃	5-Br	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
I-615	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
I-616	Me	5-Cl	CH	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
I-617	Me	5-Me	CH	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
I-618	H	5-Br	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
I-619	Me	5-Cl	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
I-620	Me	5-Br	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
I-621	Me	5-Me	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
I-622	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
I-623	CF ₃	5-Br	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
I-624	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
I-625	Me	5-Cl	CH	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
I-626	Me	5-Me	CH	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
I-627	H	5-Br	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
I-628	Me	5-Cl	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
I-629	Me	5-Br	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
I-630	Me	5-Me	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
I-631	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
I-632	CF ₃	5-Br	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
I-633	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
I-634	H	5-Br	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
I-635	Me	5-Cl	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
I-636	Me	5-Br	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
I-637	Me	5-Me	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
I-638	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
I-639	CF ₃	5-Br	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
I-640	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	

(表20)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-641	Me	5-Me	CH	OCH ₂ CH ₂ Cl	OCH ₂ CH ₂ Cl	131-132
I-642	Me	5-Cl	CH	OCH ₂ CH ₂ Cl	OCH ₂ CH ₂ Cl	
I-643	Me	5-Me	N	OCH ₂ CH ₂ Cl	OCH ₂ CH ₂ Cl	
I-644	Me	5-Cl	N	OCH ₂ CH ₂ Cl	OCH ₂ CH ₂ Cl	
I-645	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ CH ₂ Cl	OCH ₂ CH ₂ Cl	
I-646	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ CH ₂ Cl	OCH ₂ CH ₂ Cl	
I-647	Me	5-Cl	N	OCH ₂ CH ₂ F	OCH ₂ CH ₂ F	
I-648	Me	5-Me	N	OCH ₂ CH ₂ F	OCH ₂ CH ₂ F	
I-649	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ CH ₂ F	OCH ₂ CH ₂ F	
I-650	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ CH ₂ F	OCH ₂ CH ₂ F	
I-651	Me	5-Cl	N	OCH ₂ CF ₃	OCH ₂ CF ₃	
I-652	Me	5-Me	N	OCH ₂ CF ₃	OCH ₂ CF ₃	
I-653	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ CF ₃	OCH ₂ CF ₃	
I-654	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ CF ₃	OCH ₂ CF ₃	
I-655	H	H	CH	OBn	OBn	138-139
I-656	H	H	N	OBn	OBn	
I-657	H	H	N	OBn(4-Cl)	OBn(4-Cl)	
I-658	H	H	N	OBn(4-Me)	OBn(4-Me)	
I-659	H	H	N	OBn(4-OMe)	OBn(4-OMe)	
I-660	H	H	CH	OMe	OPh	114-116
I-661	H	H	N	OMe	OPh	
I-662	H	H	N	OMe	OPh(4-Cl)	
I-663	H	H	N	OMe	OPh(4-Me)	
I-664	H	H	N	OMe	OPh(4-OMe)	
I-665	H	H	CH	OMe	OCHF ₂	173-176
I-666	H	H	N	OMe	OCHF ₂	
I-667	H	H	CH	OMe	H	
I-668	Me	H	CH	OMe	H	
I-669	H	5-Cl	CH	OMe	H	
I-670	H	5-Me	CH	OMe	H	140-142
I-671	Me	5-Cl	CH	OMe	H	
I-672	Me	5-Me	CH	OMe	H	
I-673	Me	5-CF ₃	CH	OMe	H	
I-674	Me	5-OMe	CH	OMe	H	

(表21)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-675	Me	6-Cl	CH	OMe	H	126-130
I-676	Me	5,6-(OMe) ₂	CH	OMe	H	
I-677	Cl	5-Cl	CH	OMe	H	
I-678	Cl	5-Me	CH	OMe	H	
I-679	Cl	5-CF ₃	CH	OMe	H	
I-680	Cl	5-OMe	CH	OMe	H	107-108
I-681	Cl	5,6-(OMe) ₂	CH	OMe	H	
I-682	CF ₃	5-Cl	CH	OMe	H	
I-683	CF ₃	5-Me	CH	OMe	H	
I-684	CF ₃	5-CF ₃	CH	OMe	H	
I-685	CF ₃	5-OMe	CH	OMe	H	76-79
I-686	Et	5-Cl	CH	OMe	H	
I-687	Et	5-Me	CH	OMe	H	
I-688	Et	5-CF ₃	CH	OMe	H	
I-689	Et	5-OMe	CH	OMe	H	
I-690	H	H	CH	OEt	H	104-107
I-691	Me	H	CH	OEt	H	
I-692	H	5-Cl	CH	OEt	H	
I-693	H	5-Me	CH	OEt	H	
I-694	Me	5-Cl	CH	OEt	H	
I-695	Me	5-Me	CH	OEt	H	158-160
I-696	Me	5-CF ₃	CH	OEt	H	
I-697	Me	5-OMe	CH	OEt	H	
I-698	Me	5,6-(OMe) ₂	CH	OEt	H	
I-699	Me	6-Cl	CH	OEt	H	
I-700	Cl	5-Me	CH	OEt	H	131-132
I-701	Cl	5-CF ₃	CH	OEt	H	
I-702	Cl	5-OMe	CH	OEt	H	
I-703	Cl	5,6-(OMe) ₂	CH	OEt	H	
I-704	CF ₃	5-Cl	CH	OEt	H	
I-705	CF ₃	5-Me	CH	OEt	H	153-155
I-706	CF ₃	5-OMe	CH	OEt	H	
I-707	Et	5-Cl	CH	OEt	H	
I-708	Et	5-Me	CH	OEt	H	
						109-111
						117-118
						125-128
						86-87

(表22)

化合物 番号	X	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-709	Et	5-CF ₃	CH	OE _t	H	83-86
I-710	Et	5-OMe	CH	OE _t	H	
I-711	H	H	CH	OPr	H	
I-712	Me	5-Me	CH	OPr	H	
I-713	Me	5-Cl	CH	OPr	H	
I-714	Me	5-OMe	CH	OPr	H	
I-715	H	H	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	H	
I-716	Me	5-Me	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	H	
I-717	Me	5-Cl	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	H	
I-718	Me	5-OMe	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	H	
I-719	H	H	CH	OBn	H	
I-720	Me	5-Me	CH	OBn	H	257-260
I-721	Me	5-Cl	CH	OBn	H	
I-722	H	H	CH	OPh	H	
I-723	H	H	CH	OPh(4-Cl)	H	
I-724	H	H	CH	OPh(4-Me)	H	
I-725	H	H	CH	OPh(4-OMe)	H	107-110
I-726	H	H	CH	OMe	Me	
I-727	Me	H	CH	OMe	Me	
I-728	H	5-Cl	CH	OMe	Me	
I-729	H	5-Me	CH	OMe	Me	
I-730	H	5-CF ₃	CH	OMe	Me	124-127
I-731	Me	5-Cl	CH	OMe	Me	
I-732	Me	5-Me	CH	OMe	Me	
I-733	Me	5-CF ₃	CH	OMe	Me	
I-734	Me	5-OMe	CH	OMe	Me	
I-735	Me	6-Cl	CH	OMe	Me	
I-736	Me	5,6-(OMe) ₂	CH	OMe	Me	
I-737	Cl	5-Cl	CH	OMe	Me	
I-738	Cl	5-Me	CH	OMe	Me	
I-739	Cl	5-OMe	CH	OMe	Me	
I-740	Cl	5,6-(OMe) ₂	CH	OMe	Me	
I-741	CF ₃	5-Cl	CH	OMe	Me	
I-742	CF ₃	5-Me	CH	OMe	Me	

(表23)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-743	CF ₃	5-OMe	CH	OMe	Me	124-127
I-744	Et	5-Cl	CH	OMe	Me	
I-745	Et	5-Me	CH	OMe	Me	
I-746	Et	5-OMe	CH	OMe	Me	
I-747	H	H	N	OMe	Me	
I-748	H	5-Cl	N	OMe	Me	
I-749	H	5-Me	N	OMe	Me	
I-750	H	5-CF ₃	N	OMe	Me	
I-751	Me	5-Cl	N	OMe	Me	
I-752	Me	5-Me	N	OMe	Me	
I-753	Me	5-CF ₃	N	OMe	Me	
I-754	Me	5-OMe	N	OMe	Me	117-120
I-755	Me	6-Cl	N	OMe	Me	
I-756	Me	5,6-(OMe) ₂	N	OMe	Me	
I-757	Cl	5-Cl	N	OMe	Me	
I-758	Cl	5-Me	N	OMe	Me	
I-759	Cl	5-OMe	N	OMe	Me	
I-760	Cl	5,6-(OMe) ₂	N	OMe	Me	117-120
I-761	CF ₃	5-Cl	N	OMe	Me	
I-762	CF ₃	5-Me	N	OMe	Me	
I-763	CF ₃	5-OMe	N	OMe	Me	
I-764	Et	5-Cl	N	OMe	Me	
I-765	Et	5-Me	N	OMe	Me	
I-766	Et	5-OMe	N	OMe	Me	> 300
I-767	NH ₂	5-Me	N	OMe	Me	
I-768	H	H	CH	OEt	Me	57-60
I-769	Me	H	CH	OEt	Me	92-94
I-770	CF ₃	H	CH	OEt	Me	95-96
I-771	Cl	H	CH	OEt	Me	
I-772	H	5-Me	CH	OEt	Me	
I-773	Me	5-F	CH	OEt	Me	105-108
I-774	Me	5-Cl	CH	OEt	Me	
I-775	Me	5-Me	CH	OEt	Me	
I-776	Me	5-CF ₃	CH	OEt	Me	

(表24)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-777	Me	5-OMe	CH	OEt	Me	117-118
I-778	Me	5-CN	CH	OEt	Me	
I-779	Me	6-Cl	CH	OEt	Me	
I-780	Me	5,6-(OMe) ₂	CH	OEt	Me	
I-781	Cl	5-Cl	CH	OEt	Me	
I-782	Cl	5-Me	CH	OEt	Me	
I-783	Cl	5-CF ₃	CH	OEt	Me	
I-784	Cl	5-OMe	CH	OEt	Me	
I-785	Cl	5,6-(OMe) ₂	CH	OEt	Me	
I-786	CF ₃	5-Cl	CH	OEt	Me	
I-787	CF ₃	5-Me	CH	OEt	Me	
I-788	CF ₃	5-OMe	CH	OEt	Me	
I-789	Et	5-Cl	CH	OEt	Me	
I-790	Et	5-Me	CH	OEt	Me	
I-791	Et	5-CF ₃	CH	OEt	Me	
I-792	Et	5-OMe	CH	OEt	Me	
I-793	H	H	N	OEt	Me	
I-794	H	5-Br	N	OEt	Me	
I-795	Me	5-Cl	N	OEt	Me	
I-796	Me	5-Br	N	OEt	Me	
I-797	Me	5-Me	N	OEt	Me	
I-798	Me	5-CF ₃	N	OEt	Me	
I-799	Cl	5-Cl	N	OEt	Me	
I-800	Cl	5-Me	N	OEt	Me	
I-801	CF ₃	5-Cl	N	OEt	Me	
I-802	CF ₃	5-Br	N	OEt	Me	
I-803	CF ₃	5-Me	N	OEt	Me	
I-804	H	H	CH	OPr	Me	47-50
I-805	H	5-OMe	CH	OPr	Me	100-102
I-806	Me	H	CH	OPr	Me	75-78
I-807	CF ₃	H	CH	OPr	Me	
I-808	H	5-Cl	CH	OPr	Me	
I-809	H	5-Me	CH	OPr	Me	73-76
I-810	Me	5-F	CH	OPr	Me	

(表25)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-811	Me	5-Cl	CH	OPr	Me	90-93
I-812	Me	5-Me	CH	OPr	Me	59-62
I-813	Me	5-OMe	CH	OPr	Me	99-101
I-814	Me	6-Cl	CH	OPr	Me	109-112
I-815	Me	5,6-(OMe) ₂	CH	OPr	Me	
I-816	Cl	5-Cl	CH	OPr	Me	
I-817	Cl	5-Me	CH	OPr	Me	76-77
I-818	Cl	5-OMe	CH	OPr	Me	87-90
I-819	Cl	5,6-(OMe) ₂	CH	OPr	Me	
I-820	CF ₃	5-Cl	CH	OPr	Me	
I-821	CF ₃	5-Me	CH	OPr	Me	
I-822	CF ₃	5-CF ₃	CH	OPr	Me	
I-823	CF ₃	5-OMe	CH	OPr	Me	
I-824	Et	5-Cl	CH	OPr	Me	
I-825	Et	5-Me	CH	OPr	Me	
I-826	Et	5-OMe	CH	OPr	Me	
I-827	H	H	N	OPr	Me	
I-828	H	5-Br	N	OPr	Me	
I-829	Me	5-Cl	N	OPr	Me	
I-830	Me	5-Br	N	OPr	Me	
I-831	Me	5-Me	N	OPr	Me	104-107
I-832	Me	5-CF ₃	N	OPr	Me	
I-833	Cl	5-Cl	N	OPr	Me	
I-834	Cl	5-Me	N	OPr	Me	
I-835	CF ₃	5-Cl	N	OPr	Me	
I-836	CF ₃	5-Br	N	OPr	Me	
I-837	CF ₃	5-Me	N	OPr	Me	
I-838	NH ₂	5-Me	N	OPr	Me	152-153
I-839	H	H	CH	OPr-i	Me	66-68
I-840	Me	H	CH	OPr-i	Me	1.5805
I-841	CF ₃	H	CH	OPr-i	Me	
I-842	H	5-Cl	CH	OPr-i	Me	
I-843	H	5-Me	CH	OPr-i	Me	
I-844	Me	5-F	CH	OPr-i	Me	

(表26)

化合物 番号	X	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-845	Me	5-Cl	CH	OPr-i	Me	
I-846	Me	5-Me	CH	OPr-i	Me	
I-847	Me	5-OMe	CH	OPr-i	Me	
I-848	Me	6-Cl	CH	OPr-i	Me	
I-849	Me	5,6-(OMe) ₂	CH	OPr-i	Me	
I-850	Cl	5-Cl	CH	OPr-i	Me	
I-851	Cl	5-Me	CH	OPr-i	Me	
I-852	Cl	5-CF ₃	CH	OPr-i	Me	
I-853	Cl	5-OMe	CH	OPr-i	Me	
I-854	Cl	5,6-(OMe) ₂	CH	OPr-i	Me	
I-855	CF ₃	5-Cl	CH	OPr-i	Me	
I-856	CF ₃	5-Me	CH	OPr-i	Me	
I-857	CF ₃	5-OMe	CH	OPr-i	Me	
I-858	Et	5-Cl	CH	OPr-i	Me	
I-859	Et	5-Me	CH	OPr-i	Me	
I-860	Et	5-OMe	CH	OPr-i	Me	
I-861	H	H	N	OPr-i	Me	
I-862	H	5-Br	N	OPr-i	Me	
I-863	Me	5-Cl	N	OPr-i	Me	
I-864	Me	5-Br	N	OPr-i	Me	
I-865	Me	5-Me	N	OPr-i	Me	
I-866	Me	5-CF ₃	N	OPr-i	Me	
I-867	Cl	5-Cl	N	OPr-i	Me	
I-868	Cl	5-Me	N	OPr-i	Me	
I-869	CF ₃	5-Cl	N	OPr-i	Me	
I-870	CF ₃	5-Br	N	OPr-i	Me	
I-871	CF ₃	5-Me	N	OPr-i	Me	
I-872	H	H	CH	OBu	Me	1.5795
I-873	Me	H	CH	OBu	Me	73-76
I-874	Me	5-Cl	CH	OBu	Me	
I-875	Me	5-Me	CH	OBu	Me	
I-876	Me	5-OMe	CH	OBu	Me	
I-877	Cl	5-Cl	CH	OBu	Me	
I-878	Cl	5-Me	CH	OBu	Me	

(表27)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-879	Cl	5-OMe	CH	OBu	Me	55-58
I-880	CF ₃	5-Cl	CH	OBu	Me	
I-881	CF ₃	5-Me	CH	OBu	Me	
I-882	CF ₃	5-OMe	CH	OBu	Me	
I-883	H	H	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
I-884	H	5-Me	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
I-885	Me	H	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
I-886	Me	5-Cl	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
I-887	Me	5-Me	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
I-888	Me	5-OMe	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
I-889	Cl	5-Cl	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	84-87
I-890	Cl	5-Me	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
I-891	CF ₃	5-Cl	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
I-892	CF ₃	5-Me	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
I-893	CF ₃	5-OMe	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
I-894	H	H	CH	OCH ₂ C≡CH	Me	
I-895	H	5-Me	CH	OCH ₂ C≡CH	Me	
I-896	Me	H	CH	OCH ₂ C≡CH	Me	
I-897	Me	5-Cl	CH	OCH ₂ C≡CH	Me	
I-898	Me	5-Me	CH	OCH ₂ C≡CH	Me	
I-899	Me	5-OMe	CH	OCH ₂ C≡CH	Me	145-148
I-900	Cl	5-Cl	CH	OCH ₂ C≡CH	Me	
I-901	Cl	5-Me	CH	OCH ₂ C≡CH	Me	
I-902	CF ₃	5-Cl	CH	OCH ₂ C≡CH	Me	
I-903	CF ₃	5-Me	CH	OCH ₂ C≡CH	Me	
I-904	NH ₂	5-Me	CH	OCH ₂ C≡CH	Me	
I-905	H	H	CH	OBn	Me	
I-906	H	H	CH	OPn-c	Me	
I-907	Me	H	CH	OPn-c	Me	
I-908	Me	5-Cl	CH	OPn-c	Me	
I-909	Me	5-Cl	N	OPn-c	Me	1.5965
I-910	H	H	CH	SMe	Me	
I-911	Me	H	CH	SMe	Me	
I-912	Me	5-Me	CH	SMe	Me	

(表28)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-913	Me	5-Cl	CH	SMe	Me	134-137
I-914	H	H	N	SMe	Me	
I-915	Me	5-Me	N	SMe	Me	
I-916	Me	5-Cl	N	SMe	Me	
I-917	H	H	CH	OMe	Et	
I-918	Me	5-Me	CH	OMe	Et	
I-919	Me	5-Cl	CH	OMe	Et	
I-920	Me	5-CF ₃	CH	OMe	Et	
I-921	Me	5-OMe	CH	OMe	Et	
I-922	Cl	5-Me	CH	OMe	Et	
I-923	Cl	5-Cl	CH	OMe	Et	
I-924	H	H	CH	OEt	Et	
I-925	Me	5-Me	CH	OEt	Et	
I-926	Me	5-Cl	CH	OEt	Et	
I-927	Me	5-CF ₃	CH	OEt	Et	
I-928	Me	5-OMe	CH	OEt	Et	
I-929	Cl	5-Me	CH	OEt	Et	
I-930	Cl	5-Cl	CH	OEt	Et	
I-931	H	H	CH	OPr	Et	
I-932	Me	5-Me	CH	OPr	Et	
I-933	Me	5-Cl	CH	OPr	Et	
I-934	Me	5-CF ₃	CH	OPr	Et	
I-935	Me	5-OMe	CH	OPr	Et	
I-936	Cl	5-Me	CH	OPr	Et	
I-937	Cl	5-Cl	CH	OPr	Et	
I-938	H	H	N	OMe	Et	125-128
I-939	H	5-Br	N	OMe	Et	
I-940	Me	5-Me	N	OMe	Et	
I-941	Me	5-Cl	N	OMe	Et	134-137
I-942	Me	5-Br	N	OMe	Et	134-141
I-943	Cl	5-Me	N	OMe	Et	86-89
I-944	Cl	5-Cl	N	OMe	Et	
I-945	CF ₃	5-Me	N	OMe	Et	
I-946	CF ₃	5-Cl	N	OMe	Et	79-82

(表29)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-947	CF ₃	5-Br	N	OMe	Et	97-100
I-948	H	H	N	OEt	Et	79-82
I-949	H	5-Br	N	OEt	Et	
I-950	Me	5-Me	N	OEt	Et	
I-951	Me	5-Cl	N	OEt	Et	
I-952	Me	5-Br	N	OEt	Et	96-98
I-953	Cl	5-Me	N	OEt	Et	
I-954	Cl	5-Cl	N	OEt	Et	
I-955	CF ₃	5-Me	N	OEt	Et	
I-956	CF ₃	5-Cl	N	OEt	Et	66-67
I-957	CF ₃	5-Br	N	OEt	Et	97-100
I-958	H	H	CH	OMe	Pr	78-80
I-959	Me	H	CH	OMe	Pr	1.5892
I-960	Cl	H	CH	OMe	Pr	1.6009
I-961	H	5-Cl	CH	OMe	Pr	116-119
I-962	H	5-Me	CH	OMe	Pr	
I-963	Me	5-F	CH	OMe	Pr	
I-964	Me	5-Cl	CH	OMe	Pr	
I-965	Me	5-Me	CH	OMe	Pr	105-107
I-966	Me	5-OMe	CH	OMe	Pr	
I-967	Me	6-Cl	CH	OMe	Pr	68-71
I-968	Cl	5-Cl	CH	OMe	Pr	
I-969	Cl	5-Me	CH	OMe	Pr	
I-970	Cl	5-OMe	CH	OMe	Pr	
I-971	CF ₃	5-Cl	CH	OMe	Pr	
I-972	CF ₃	5-Me	CH	OMe	Pr	
I-973	CF ₃	5-OMe	CH	OMe	Pr	
I-974	H	H	CH	OEt	Pr	
I-975	H	5-Cl	CH	OEt	Pr	
I-976	H	5-Me	CH	OEt	Pr	
I-977	Me	5-F	CH	OEt	Pr	
I-978	Me	5-Cl	CH	OEt	Pr	
I-979	Me	5-Me	CH	OEt	Pr	
I-980	Me	5-CF ₃	CH	OEt	Pr	

(表30)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-981	Me	5-OMe	CH	OEt	Pr	112-115
I-982	Cl	5-Cl	CH	OEt	Pr	
I-983	Cl	5-Me	CH	OEt	Pr	
I-984	Cl	5-CF ₃	CH	OEt	Pr	
I-985	Cl	5-OMe	CH	OEt	Pr	
I-986	CF ₃	5-Cl	CH	OEt	Pr	
I-987	CF ₃	5-Me	CH	OEt	Pr	
I-988	CF ₃	5-OMe	CH	OEt	Pr	
I-989	H	H	CH	OPr	Pr	
I-990	Me	5-Me	CH	OPr	Pr	
I-991	Me	5-Cl	CH	OPr	Pr	
I-992	Me	5-OMe	CH	OPr	Pr	
I-993	Cl	5-Me	CH	OPr	Pr	
I-994	Cl	5-Cl	CH	OPr	Pr	
I-995	H	H	N	OMe	Pr	
I-996	H	5-Br	N	OMe	Pr	
I-997	Me	5-Cl	N	OMe	Pr	
I-998	Me	5-Br	N	OMe	Pr	
I-999	Me	5-Me	N	OMe	Pr	
I-1000	Cl	5-Cl	N	OMe	Pr	
I-1001	Cl	5-Me	N	OMe	Pr	92-95
I-1002	CF ₃	5-Cl	N	OMe	Pr	
I-1003	CF ₃	5-Br	N	OMe	Pr	
I-1004	CF ₃	5-Me	N	OMe	Pr	
I-1005	H	H	N	OEt	Pr	
I-1006	H	5-Br	N	OEt	Pr	
I-1007	Me	5-Cl	N	OEt	Pr	
I-1008	Me	5-Br	N	OEt	Pr	
I-1009	Me	5-Me	N	OEt	Pr	
I-1010	Cl	5-Cl	N	OEt	Pr	
I-1011	Cl	5-Me	N	OPr	Pr	
I-1012	CF ₃	5-Cl	N	OPr	Pr	
I-1013	CF ₃	5-Br	N	OPr	Pr	
I-1014	CF ₃	5-Me	N	OPr	Pr	

(表31)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-1015	H	H	N	OMe	Pr-c	
I-1016	H	5-Br	N	OMe	Pr-c	154-157
I-1017	Me	5-Cl	N	OMe	Pr-c	116-119
I-1018	Me	5-Br	N	OMe	Pr-c	121-124
I-1019	Me	5-Me	N	OMe	Pr-c	167-170
I-1020	CF ₃	5-Cl	N	OMe	Pr-c	101-104
I-1021	CF ₃	5-Br	N	OMe	Pr-c	119-122
I-1022	CF ₃	5-Me	N	OMe	Pr-c	116-119
I-1023	H	H	N	OE _t	Pr-c	
I-1024	H	5-Br	N	OE _t	Pr-c	137-140
I-1025	Me	5-Cl	N	OE _t	Pr-c	130-133
I-1026	Me	5-Br	N	OE _t	Pr-c	124-127
I-1027	Me	5-Me	N	OE _t	Pr-c	131-133
I-1028	CF ₃	5-Cl	N	OE _t	Pr-c	82-85
I-1029	CF ₃	5-Br	N	OE _t	Pr-c	105-108
I-1030	CF ₃	5-Me	N	OE _t	Pr-c	79-82
I-1031	H	H	N	SMe	Pr-c	
I-1032	H	5-Br	N	SMe	Pr-c	
I-1033	Me	5-Cl	N	SMe	Pr-c	
I-1034	Me	5-Br	N	SMe	Pr-c	
I-1035	Me	5-Me	N	SMe	Pr-c	
I-1036	CF ₃	5-Cl	N	SMe	Pr-c	
I-1037	CF ₃	5-Br	N	SMe	Pr-c	
I-1038	CF ₃	5-Me	N	SMe	Pr-c	
I-1039	Me	H	CH	SMe	SMe	129-131
I-1040	H	5-Cl	N	SMe	SMe	
I-1041	H	5-Br	N	SMe	SMe	
I-1042	Me	H	N	SMe	SMe	176-179
I-1043	Me	5-Cl	N	SMe	SMe	186-189
I-1044	Me	5-Br	N	SMe	SMe	
I-1045	Me	5-Me	N	SMe	SMe	
I-1046	CF ₃	5-Cl	N	SMe	SMe	144-146
I-1047	CF ₃	5-Br	N	SMe	SMe	
I-1048	CF ₃	5-Me	N	SMe	Me	106-109

(表32)

化合物 番号	X	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-1049	H	5-Br	N	OMe	SMe	
I-1050	Me	5-Cl	N	OMe	SMe	
I-1051	Me	5-Br	N	OMe	SMe	
I-1052	Me	5-Me	N	OMe	SMe	
I-1053	CF ₃	5-Cl	N	OMe	SMe	
I-1054	CF ₃	5-Br	N	OMe	SMe	
I-1055	CF ₃	5-Me	N	OMe	SMe	
I-1056	H	H	CH	OMe	Ph	160-162
I-1057	H	H	N	OMe	Ph	
I-1058	Me	5-Me	N	OMe	Ph	165-168
I-1059	CF ₃	6-Me	N	OMe	Ph	150-153
I-1060	H	H	CH	Cl	Ph	176-179
I-1061	H	H	N	Cl	Ph	
I-1062	H	H	CH	Cl	Cl	165-168
I-1063	Me	H	CH	Cl	Cl	170-172
I-1064	Me	5,6-Cl ₂	CH	Cl	Cl	202-205
I-1065	H	H	N	Cl	Cl	
I-1066	Me	H	N	Cl	Cl	> 300
I-1067	H	H	CH	Cl	Me	187-190
I-1068	Me	H	CH	Cl	Me	122-125
I-1069	H	H	CH	Cl	N(Me) ₂	205-208
I-1070	H	H	N	Cl	N(Me) ₂	
I-1071	Me	5-Cl	N	N(Me) ₂	N(Me) ₂	203-206
I-1072	H	H	CH	OMe	N(Me) ₂	129-132
I-1073	H	H	CBr	OMe	OMe	>300
I-1074	H	H	CMe	OMe	OMe	152-155
I-1075	H	H	CMe	Cl	Cl	184-187
I-1076	H	H	COMe	H	H	131-134
I-1077	Me	5-Me	COMe	H	H	
I-1078	Me	5-Cl	COMe	H	H	
I-1079	H	H	CH	Me	Me	131-132
I-1080	Me	5-Cl	CH	Me	Me	138-140
I-1081	Me	5-CF ₃	CH	Me	Me	
I-1082	H	H	CH	Me	CF ₃	107-110

(表33)

化合物 番号	X	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-1083	Me	5-Cl	CH	Me	CF ₃	60-63
I-1084	Me	5-Cl	N	Me	CF ₃	
I-1085	H	H	CH	Me	Et	
I-1086	H	5-Me	CH	Me	Et	55-58
I-1087	Me	5-Me	CH	Me	Et	109-112
I-1088	Me	5-Cl	CH	Me	Et	76-79
I-1089	Me	5-OMe	CH	Me	Et	84-87
I-1090	Me	6-Cl	CH	Me	Et	
I-1091	Cl	5-Cl	CH	Me	Et	
I-1092	Cl	5-Me	CH	Me	Et	58-61
I-1093	H	H	CH	Et	Et	
I-1094	H	5-Me	CH	Et	Et	
I-1095	Me	5-Me	CH	Et	Et	76-79
I-1096	Me	5-Cl	CH	Et	Et	78-80
I-1097	Me	5-OMe	CH	Et	Et	80-83
I-1098	Me	6-Cl	CH	Et	Et	
I-1099	Cl	5-Cl	CH	Et	Et	
I-1100	Cl	5-Me	CH	Et	Et	124-125
I-1101	H	H	CH	Me	Pr-c	
I-1102	H	5-Me	CH	Me	Pr-c	
I-1103	Me	5-Me	CH	Me	Pr-c	153-156
I-1104	Me	5-Cl	CH	Me	Pr-c	119-122
I-1105	Me	5-OMe	CH	Me	Pr-c	110-113
I-1106	Me	6-Cl	CH	Me	Pr-c	
I-1107	Cl	5-Cl	CH	Me	Pr-c	
I-1108	Cl	5-Me	CH	Me	Pr-c	110-113
I-1109	H	H	CH	Et	Pr-c	
I-1110	Me	5-Me	CH	Et	Pr-c	
I-1111	Me	5-Cl	CH	Et	Pr-c	110-113
I-1112	Me	5-OMe	CH	Et	Pr-c	
I-1113	Me	6-Cl	CH	Et	Pr-c	
I-1114	Cl	5-Cl	CH	Et	Pr-c	110-113
I-1115	Cl	5-Me	CH	Et	Pr-c	
I-1116	H	H	CH	Et	Et	

(表34)

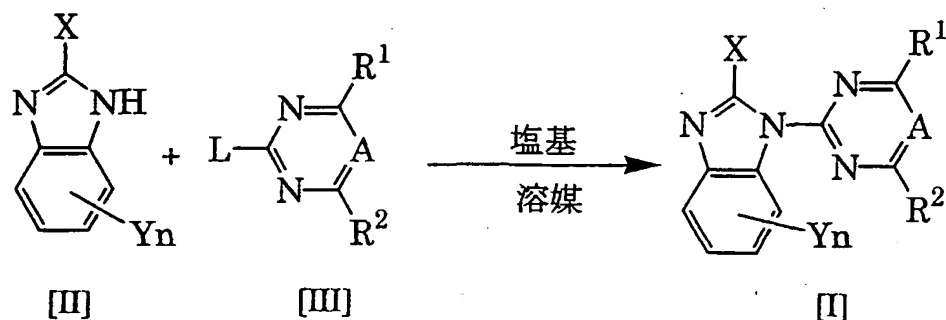
化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-1117	Me	5-Me	CH	Et	Et	134-136
I-1118	Me	5-Cl	CH	Et	Et	
I-1119	Me	5-OMe	CH	Et	Et	
I-1120	Me	6-Cl	CH	Et	Et	
I-1121	Cl	5-Cl	CH	Et	Et	
I-1122	Cl	5-Me	CH	Et	Et	
I-1123	H	H	CH	C≡CMe	Me	
I-1124	Me	5-Me	CH	C≡CMe	Me	
I-1125	Me	5-Cl	CH	C≡CMe	Me	
I-1126	Me	5-Me	N	C≡CMe	Me	
I-1127	Me	5-Cl	N	C≡CMe	Me	
I-1128	Cl	5-Cl	CH	C≡CMe	Me	
I-1129	Cl	5-Me	CH	C≡CMe	Me	
I-1130	H	H	CH	CH=CH ₂	Me	
I-1131	Me	5-Me	CH	CH=CH ₂	Me	
I-1132	Me	5-Cl	CH	CH=CH ₂	Me	
I-1133	Me	5-Me	N	CH=CH ₂	Me	
I-1134	Cl	5-Cl	CH	CH=CH ₂	Me	
I-1135	Cl	5-Me	CH	CH=CH ₂	Me	
I-1136	H	H	CH	CHO	Me	
I-1137	Me	5-Cl	CH	CHO	Me	
I-1138	Me	5-Cl	N	CHO	Me	
I-1139	H	H	CH	COMe	Me	
I-1140	Me	5-Cl	CH	COMe	Me	
I-1141	Me	5-Cl	N	COMe	Me	
I-1142	H	H	CH	CH ₂ OMe	Me	
I-1143	Me	5-Cl	CH	CH ₂ OMe	Me	
I-1144	Me	5-Me	CH	CH ₂ OMe	Me	
I-1145	H	H	N	CH ₂ OMe	OMe	
I-1146	Me	H	CH	CN	CN	187-189
I-1147	Me	H	CH	CN	Me	
I-1148	Me	H	N	CN	CN	
I-1149	Me	H	N	CN	Me	
I-1150	Me	H	CH	SO ₂ Me	SO ₂ Me	

(表35)

化合物 番号	X	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
I-1151	Me	H	N	SO ₂ Me	SO ₂ Me	
I-1152	Me	H	CH	SO ₂ Me	Me	183-186

本発明化合物である一般式 [I] で示されるピリミジニルベンズイミダゾールおよびトリアジニルベンズイミダゾール誘導体の代表的な製造法を以下に例示する。

<製造法 1>



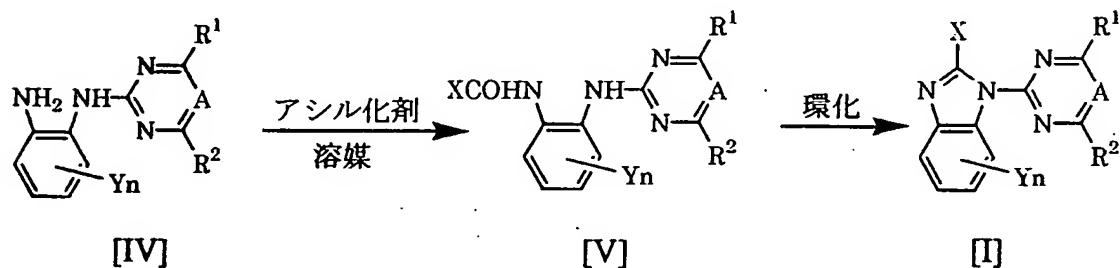
(式中、X、Y、R¹、R²、A 及び n はそれぞれ前記と同じ意味を表し、L はハロゲン原子、(C₁–C₆)アルキルスルホニル基、ベンジルスルホニル基等の脱離基を表す。)

一般式 [I] で表される本発明化合物は一般式 [II] で表されるベンズイミダゾール誘導体と一般式 [III] で表されるピリミジン誘導体、トリアジン誘導体とを塩基の存在下、溶媒中で反応させることにより製造することができる。ここで塩基としては、例えばアルカリ金属またはアルカリ土類金属、特にナトリウム及びカリウムならびにマグネシウム及びカルシウムの炭酸塩、炭酸水素塩、酢酸塩、アルコール、水酸化物、水素化物または酸化物等が使用できる。本反応で使用できる溶媒としては、本反応の進行を阻害しないものであればよく、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグリム、ジグリム等のエーテル類、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、テトラクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、クロロベンゼン、ニトロベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン、ジメチルスルホキシド等を使用することができ、これらの不活性溶媒は単独で、もしくは混合して使用することができる。反応温度は-20℃から使用する不活性

溶媒の沸点の範囲から選択すればよく、好ましくは 0℃～80℃の範囲で行うのがよい。反応時間は反応温度、反応量等により一定しないが、一般的には 1 時間～48 時間の範囲から選択すればよい。反応終了後、常法により反応系から目的物を単離し、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等で精製する。

尚、一般式 [II] で表されるベンズイミダゾール誘導体は、市販されているかあるいは一般に知られている方法〔例えば、アングewanデヘミー(Angewandte Chemie)、第 85 巻、第 866 頁(1973 年);ジャーナル オブ ジ アメリカン ケミカル ソサイエティー(Journal of the American Chemical Society)、第 69 巻、第 2459 頁(1947 年);ジャーナル オブ ジ アメリカン ケミカル ソサイエティー(Journal of the American Chemical Society)、第 82 巻、第 3138 頁(1960 年);オーガニック シンセセス(Organic Syntheses)、第 2 巻、第 65 頁(1943 年);オーガニック シンセセス(Organic Syntheses)、第 4 巻、第 569 頁(1963 年)記載の方法〕により製造する事ができる。

<製造法 2>



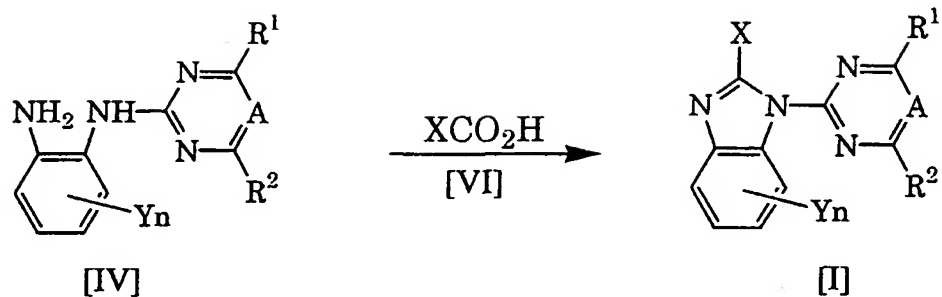
(式中、X、Y、R¹、R²、A 及び n はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

一般式 [V] で表されるアニリド誘導体は一般式 [IV] で表されるアニリノピリミジン誘導体、アニリノトリアジン誘導体を不活性溶媒中アシル化剤と反応させることにより製造される。反応は塩基の存在下で行うのが好ましい。アシル化剤としては酢酸クロリド、プロピオン酸クロリド、安息香酸クロリドのような酸ハロゲン化物または無水トリフルオロ酢酸、無水プロピオン酸、無水安息香酸のような酸無水物が挙げられる。本反応で利用できる不活性溶媒としては、本反応

の進行を阻害しないものであればよく、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグリム、ジグリム等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、テトラクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、クロロベンゼン、ニトロベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン、ジメチルスルホキシド、ピリジン、水等を使用することができ、これらの不活性溶媒は単独もしくは混合して使用することができる。本反応で使用する塩基としては、無機塩基又は有機塩基を使用することができ、例えば無機塩基としては炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等のアルカリ金属類又はアルカリ土類金属類の炭酸塩もしくは水酸化物、水素化リチウム、水素化ナトリウム等のアルカリ金属類の水素化物を使用することができ、有機塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン等を使用することができる。反応温度は-20℃から使用する不活性溶媒の沸点の範囲から選択すればよく、好ましくは0℃~50℃の範囲で行うのがよい。反応時間は反応温度、反応量等により一定しないが、一般的には数分~48時間の範囲から選択すればよい。

次いで一般式 [V] で表されるアニリド誘導体は無溶媒または、溶媒中、必要に応じて触媒の存在下、環化反応により一般式 [I] で表される本発明化合物を製造できる。ここで用いられる触媒としては、硫酸、塩酸などの無機酸、パラトルエンスルホン酸などの有機酸等を使用することができる。本反応で使用する溶媒としては、製造法 1 に例示した溶媒を使用することができる。反応温度は0℃から使用する溶媒の沸点の範囲から選択すればよく、好ましくは室温~溶媒の沸点の範囲で行うのがよい。反応時間は反応温度、反応量等により一定しないが一般的には1時間~48時間の範囲から選択すればよい。反応終了後、常法により反応系から目的物を単離し、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等で精製する。

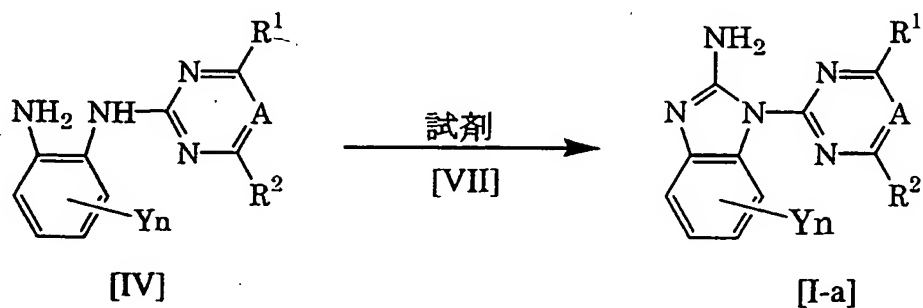
<製造法 3>



(式中、X、Y、R¹、R²、A 及び n はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

一般式 [I] で表される本発明化合物は一般式 [IV] で表されるアニリノピリミジン誘導体、アニリノトリアジン誘導体を一般式 [VI] で表されるカルボン酸中、必要に応じて酸無水物存在下で加熱することで直接製造することができる。反応温度は 0℃～使用するカルボン酸の沸点の範囲から選択すればよく、好ましくは室温～カルボン酸の沸点の範囲で行うのがよい。反応時間は一般的には 1 時間～48 時間の範囲から選択すればよい。反応終了後、常法により反応系から目的物を単離し、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等で精製する。

<製造法 4>



(式中、Y、R¹、R²、A 及び n はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

一般式 [I-a] で表される化合物は一般式 [IV] で表されるアニリノピリミジ

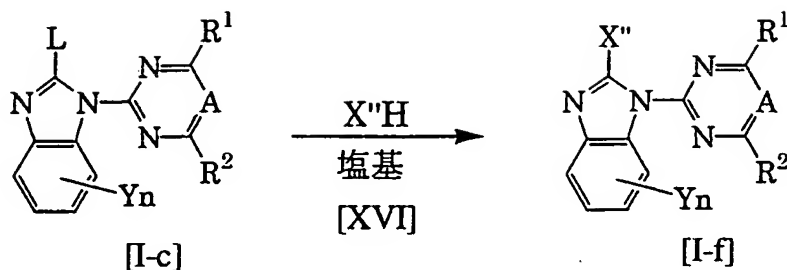
ン誘導体、アニリノトリアジン誘導体と BrCN 、 H_2NCN 等の試剤 [VII] から文献公知の方法〔例えば、ジャーナル オブ ジ アメリカン ケミカル ソサイエティー(Journal of the American Chemical Society)、第 69 巻、第 2459 頁(1947 年)；アングewannte Chemie)、第 85 巻、第 866 頁(1973 年)等に記載の方法〕を利用して溶媒中反応させることにより製造することができる。本反応で利用できる溶媒としては、製造法 1 に例示した溶媒を使用することができる。反応温度は -20°C から使用する反応混合物の沸点の範囲から選択すればよく、好ましくは 0°C ～反応混合物の沸点の範囲で行うのがよい。反応時間は反応温度、反応量等により一定しないが、一般的には 1 時間～48 時間の範囲から選択すればよい。反応終了後、常法により反応系から目的物を単離し、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等で精製する。

<製造法 5>



(式中、 X' はハロゲン原子、 Y 、 R^1 、 R^2 、 A 及び n はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

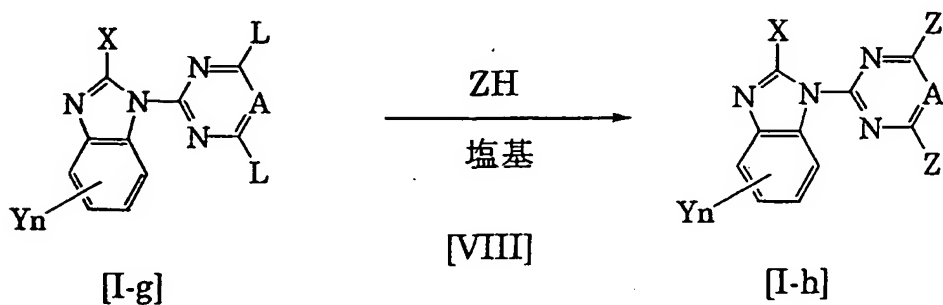
一般式 [I-d] で表される化合物は、一般式 [I-a] で表される 2-アミノベンズイミダゾール誘導体を公知の方法〔例えば、ザンドマイヤー(Sandmeyer)法、シュベッテン(Schwechten)法、ガッターマン(Gattermann)法等〕により通常用いられる溶媒、反応温度でジアゾ化した後、ハロゲン化することにより製造できる。反応終了後、常法により反応系から目的物を単離し、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等で精製する。



(式中、Y、R¹、R²、A、L 及び n はそれぞれ前記と同じ意味を表し、X''は(C₁–C₆)アルコキシ、(C₂–C₆)アルケニルオキシ、(C₂–C₆)アルキニルオキシ、(C₁–C₆)アルキルチオ、(C₁–C₆)アルキルアミノ基を表す。)

一般式 [I-f] で表される本発明化合物は、一般式 [I-c] で表されるピリミジニルベンズイミダゾール誘導体、トリアジニルベンズイミダゾール誘導体と一般式 [XVI] で表されるアルコール、メルカプタン、アミン類とを塩基の存在下、無溶媒あるいは溶媒中で反応させることにより製造することができる。本反応で利用できる塩基および溶媒としては、製造法 1 に例示した塩基および溶媒を使用することができる。反応温度は–20℃から使用する反応混合物の沸点の範囲から選択すればよく、好ましくは室温～反応混合物の沸点の範囲で行うのがよい。反応終了後、常法により反応系から目的物を単離し、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等で精製する。

<製造法 8>

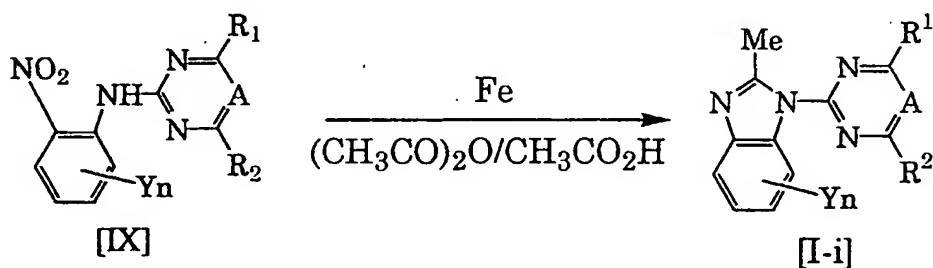


(式中、X、Y、A、L 及び n はそれぞれ前記と同じ意味を表し、Z は(C₁–C₆)アル

コキシ、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ、 (C_1-C_6) アルキルチオ、ジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基を表す。)

一般式 [I-h] で表される本発明化合物は、一般式 [I-g] で表されるピリミニルベンズイミダゾール誘導体、トリアジニルベンズイミダゾール誘導体と一般式 [VIII] で表されるアルコール、メルカプタン、アミン類とを塩基の存在下、無溶媒あるいは適当な溶媒中で反応させることにより製造することができる。本反応で使用する塩基および溶媒としては、製造法 1 に例示した塩基および溶媒を使用することができる。反応温度は -20°C から使用する反応混合物の沸点域から選択すればよく、好ましくは室温～反応混合物の沸点の範囲で行うのがよい。反応終了後、常法により反応系から目的物を単離し、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等で精製する。

<製造法 9>



(式中、Y、 R^1 、 R^2 、A 及び n はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

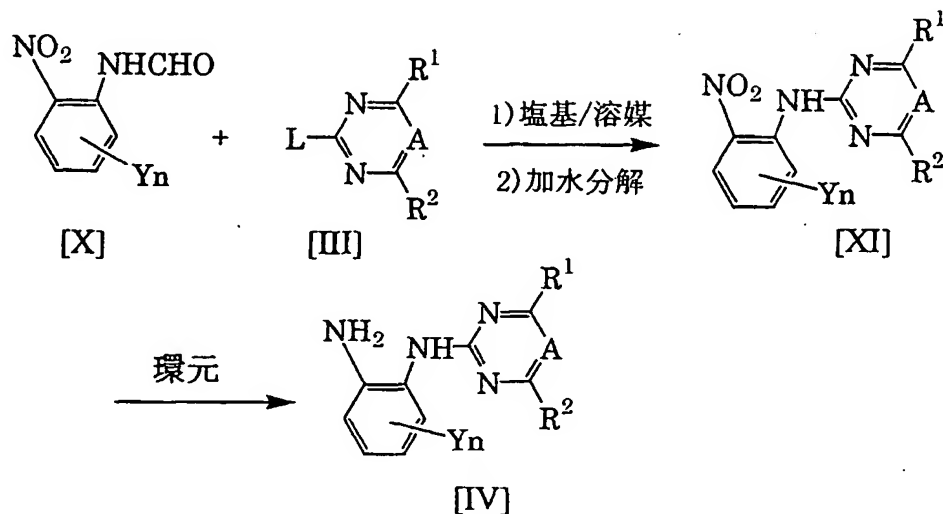
一般式 [I-i] で表される本発明化合物は、一般式 [IX] で表されるアニリノトリアジン誘導体を酢酸中、又は無水酢酸、酢酸の混合溶媒中で鉄粉還元することにより製造することができる。反応温度は -20°C から使用する反応混合物の沸点域から選択すればよく、好ましくは室温～反応混合物の沸点の範囲で行うのがよい。反応終了後、常法により反応系から目的物を単離し、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等で精製する。

次に本発明化合物の製造中間体の合成法について詳細に説明する。

<製造法 10>

一般式 [IV] で表される製造中間体の合成

化合物 [IV] は例えば以下の方法に従って合成されるが、その方法はこの限りではない。



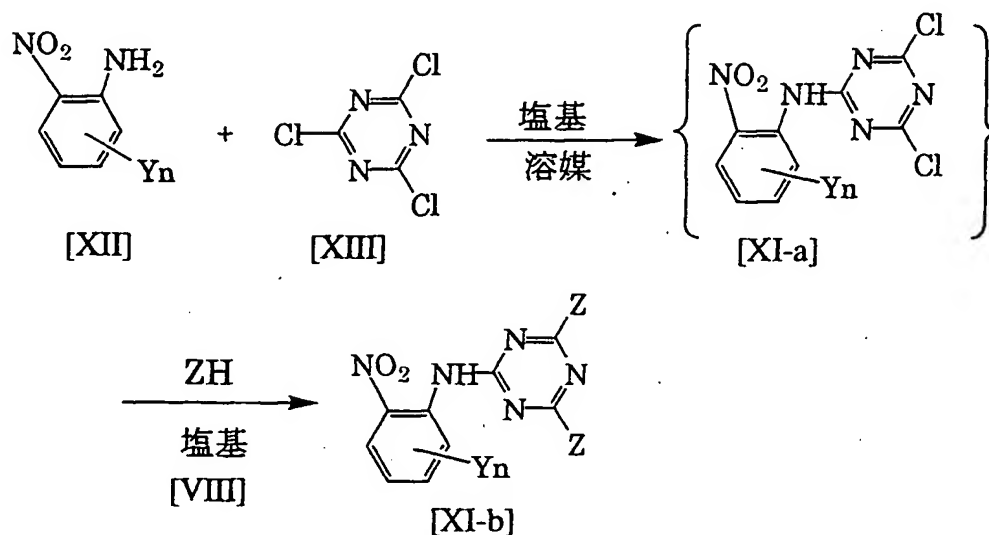
(式中、Y、R¹、R²、A、L 及び n はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

一般式 [X] で表されるホルムアニリド誘導体と一般式 [III] で表されるピリミジン誘導体、トリアジン誘導体とを塩基の存在下、不活性溶媒中で反応温度 -20℃～溶媒の沸点の範囲、好ましくは室温から 80℃の範囲で反応させる。次に塩酸、臭化水素酸、硫酸等の酸、または水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物等で、一般に知られている方法により加水分解することで [XI] を得ることができる。次に得られた [XI] を鉄、塩化錫、または他に触媒を伴った水素原子例えばパラジウム炭素、ラネーニッケル等の還元剤を用いた一般に知られた方法により還元することで一般式 [IV] で表されるアニリノピリミジン誘導体、アニリノトリアジン誘導体を製造することができる。

<製造法 11>

一般式 [XI-b] で表される製造中間体の合成

化合物 [XI-b] は例えば以下の方法に従って合成されるが、その方法はこの限りではない。



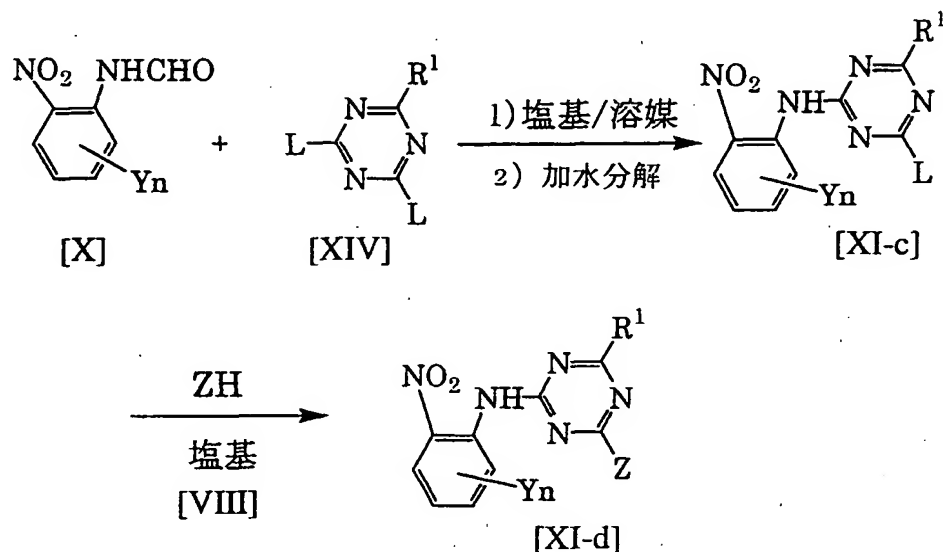
(式中、Y、Z 及び n はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

一般式 [XII] で表されるニトロアニリン誘導体と [XIII] で表される塩化シアマルとを塩基の存在下、無溶媒あるいは適当な溶媒中で反応させることにより一般式 [XI-a] で表されるアニリノトリアジン誘導体を製造した後、つづいて一般式 [VIII] で表されるアルコール、メルカプタン、アミン類とを塩基の存在下、無溶媒あるいは適当な溶媒中で反応させることにより一般式 [XI-b] で表されるアニリノトリアジン誘導体を製造することができる。本反応で利用できる塩基および溶媒としては、製造法 1 に例示した塩基および溶媒を使用することができる。反応温度は -20°C から使用する反応混合物の沸点域から選択すればよく、好ましくは室温～反応混合物の沸点の範囲で行うのがよい。反応終了後、常法により反応系から目的物を単離し、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等で精製する。

<製造法 12>

一般式 [XI-c]、[XI-d] で表される製造中間体の合成

化合物 [XI-c]、[XI-d] は例えば以下の方法に従って合成されるが、その方法はこの限りではない。

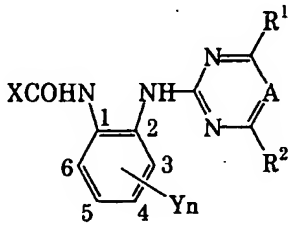


(式中、R¹、Y、L、Z 及び n はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

一般式 [X] で表されるホルムアニリド誘導体と [XIV] で表されるトリアジン誘導体とを塩基の存在下、無溶媒あるいは適当な溶媒中で反応させる。次に塩酸、臭化水素酸、硫酸等の酸、または水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物等で、一般に知られている方法により加水分解することで一般式 [XI-c] で表されるアニリノトリアジン誘導体を製造することができる。つづいて一般式 [VIII] で表されるアルコール、メルカプタン、アミン類とを塩基の存在下、無溶媒あるいは適当な溶媒中で反応させることにより一般式 [XI-d] で表されるアニリノトリアジン誘導体を製造することができる。本反応で利用できる塩基および溶媒としては、製造法 1 に例示した塩基および溶媒を使用することができる。反応温度は -20℃ から使用する反応混合物の沸点域から選択すればよく、好ましくは室温～反応混合物の沸点の範囲で行うのがよい。反応終了後、常法により反応系から目的物を単離し、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等で精製する。

尚、一般式 [IV] [V] [XI] で表されるアニリノピリミジン及びアニリノトリアジン誘導体も新規化合物であり、次にそれらの具体例を表 36～表 65 に記載する。

(表36)

						
化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-1	H	H	CH	OMe	OMe	169-172
1-2	Me	H	CH	OMe	OMe	
1-3	Et	H	CH	OMe	OMe	
1-4	Pr	H	CH	OMe	OMe	
1-5	Pr-i	H	CH	OMe	OMe	
1-6	Pr-c	H	CH	OMe	OMe	
1-7	Bu	H	CH	OMe	OMe	
1-8	Bn	H	CH	OMe	OMe	
1-9	Bn(4-Cl)	H	CH	OMe	OMe	
1-10	Bn(4-Me)	H	CH	OMe	OMe	
1-11	Bn(4-OMe)	H	CH	OMe	OMe	
1-12	CH=CH ₂	H	CH	OMe	OMe	147-149
1-13	C≡CH	H	CH	OMe	OMe	125-126
1-14	CH ₂ OEt	H	CH	OMe	OMe	
1-15	CH ₂ Cl	H	CH	OMe	OMe	
1-16	CH ₂ CH ₂ Cl	H	CH	OMe	OMe	
1-17	CH ₂ I	H	CH	OMe	OMe	162-165
1-18	CCl ₃	H	CH	OMe	OMe	
1-19	CF ₃	H	CH	OMe	OMe	
1-20	C ₂ F ₅	H	CH	OMe	OMe	
1-21	Ph	H	CH	OMe	OMe	82-85
1-22	Ph(4-Cl)	H	CH	OMe	OMe	
1-23	Ph(4-Me)	H	CH	OMe	OMe	
1-24	Ph(4-OMe)	H	CH	OMe	OMe	
1-25	H	H	N	OMe	OMe	148-152
1-26	Me	H	N	OMe	OMe	

(表 37)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-27	Et	H	N	OMe	OMe	
1-28	Pr	H	N	OMe	OMe	
1-29	Pr-i	H	N	OMe	OMe	
1-30	Pr-c	H	N	OMe	OMe	
1-31	Bu	H	N	OMe	OMe	
1-32	Bn	H	N	OMe	OMe	
1-33	Bn(4-Cl)	H	N	OMe	OMe	
1-34	Bn(4-Me)	H	N	OMe	OMe	
1-35	Bn(4-OMe)	H	N	OMe	OMe	
1-36	CH=CH ₂	H	N	OMe	OMe	
1-37	C≡CH	H	N	OMe	OMe	
1-38	CH ₂ OEt	H	N	OMe	OMe	
1-39	CH ₂ Cl	H	N	OMe	OMe	
1-40	CH ₂ I	H	N	OMe	OMe	
1-41	CCl ₃	H	N	OMe	OMe	
1-42	CF ₃	H	N	OMe	OMe	
1-43	C ₂ F ₅	H	N	OMe	OMe	
1-44	Ph	H	N	OMe	OMe	
1-45	Ph(4-Cl)	H	N	OMe	OMe	
1-46	Ph(4-Me)	H	N	OMe	OMe	
1-47	Ph(OMe)	H	N	OMe	OMe	
1-48	H	6-Me	CH	OMe	OMe	
1-49	H	6-Cl	CH	OMe	OMe	
1-50	H	5-F	CH	OMe	OMe	
1-51	H	5-Cl	CH	OMe	OMe	
1-52	H	5-Br	CH	OMe	OMe	
1-53	H	5-Me	CH	OMe	OMe	
1-54	H	5-Bu-t	CH	OMe	OMe	
1-55	H	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
1-56	H	5-OMe	CH	OMe	OMe	
1-57	H	5-OEt	CH	OMe	OMe	
1-58	H	5-OPr	CH	OMe	OMe	
1-59	H	5-OCF ₃	CH	OMe	OMe	

(表 38)

化合物 番号	X	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-60	H	5-OCH ₂ CH=CH ₂	CH	OMe	OMe	
1-61	H	5-OCH ₂ C≡CH	CH	OMe	OMe	
1-62	H	5-OPh	CH	OMe	OMe	
1-63	H	5-OPh(4-Cl)	CH	OMe	OMe	
1-64	H	5-OPh(4-Me)	CH	OMe	OMe	
1-65	H	5-OPh(4-OMe)	CH	OMe	OMe	
1-66	H	5-SMe	CH	OMe	OMe	
1-67	H	5-CH ₂ OMe	CH	OMe	OMe	
1-68	H	5-COMe	CH	OMe	OMe	
1-69	H	5-COPh	CH	OMe	OMe	
1-70	H	5-CO ₂ Et	CH	OMe	OMe	
1-71	H	5-Ph	CH	OMe	OMe	
1-72	H	5-Ph(4-Cl)	CH	OMe	OMe	
1-73	H	5-Ph(4-Me)	CH	OMe	OMe	
1-74	H	5-Ph(4-OMe)	CH	OMe	OMe	
1-75	H	5-NO ₂	CH	OMe	OMe	
1-76	H	5-NH ₂	CH	OMe	OMe	
1-77	H	5-NHMe	CH	OMe	OMe	
1-78	H	5-NMe ₂	CH	OMe	OMe	
1-79	H	5-CN	CH	OMe	OMe	
1-80	H	4-F	CH	OMe	OMe	
1-81	H	4-Cl	CH	OMe	OMe	
1-82	H	4-Me	CH	OMe	OMe	
1-83	H	4-CF ₃	CH	OMe	OMe	
1-84	H	4-OMe	CH	OMe	OMe	
1-85	H	4-CO ₂ Et	CH	OMe	OMe	
1-86	H	4-COPh	CH	OMe	OMe	
1-87	H	3-Me	CH	OMe	OMe	
1-88	H	3-Cl	CH	OMe	OMe	
1-89	H	4,5-Cl ₂	CH	OMe	OMe	
1-90	H	4,5-Me ₂	CH	OMe	OMe	
1-91	H	4,5-(OMe) ₂	CH	OMe	OMe	
1-92	H	4-CF ₃ ,6-Br	CH	OMe	OMe	

(表39)

化合物 番号	X	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-93	H	4-CF ₃ ,6-Cl	CH	OMe	OMe	
1-94	H	4,5,6-F ₃	CH	OMe	OMe	
1-95	H	6-Me	N	OMe	OMe	
1-96	H	6-Cl	N	OMe	OMe	
1-97	H	5-F	N	OMe	OMe	
1-98	H	5-Cl	N	OMe	OMe	
1-99	H	5-Br	N	OMe	OMe	
1-100	H	5-Me	N	OMe	OMe	
1-101	H	5-CF ₃	N	OMe	OMe	
1-102	H	5-OMe	N	OMe	OMe	
1-103	H	5-OEt	N	OMe	OMe	
1-104	H	5-OPr	N	OMe	OMe	
1-105	H	5-OCF ₃	N	OMe	OMe	
1-106	H	5-OCH ₂ CH=CH ₂	N	OMe	OMe	
1-107	H	5-OCH ₂ C≡CH	N	OMe	OMe	
1-108	H	5-OPh	N	OMe	OMe	
1-109	H	5-SMe	N	OMe	OMe	
1-110	H	5-COPh	N	OMe	OMe	
1-111	H	5-CO ₂ Et	N	OMe	OMe	
1-112	H	5-Ph	N	OMe	OMe	
1-113	H	5-Ph(4-Cl)	N	OMe	OMe	
1-114	H	5-Ph(4-Me)	N	OMe	OMe	
1-115	H	5-Ph(4-OMe)	N	OMe	OMe	
1-116	H	5-NO ₂	N	OMe	OMe	
1-117	H	5-NH ₂	N	OMe	OMe	
1-118	H	5-NHMe	N	OMe	OMe	
1-119	H	5-NMe ₂	N	OMe	OMe	
1-120	H	5-CN	N	OMe	OMe	
1-121	H	4-F	N	OMe	OMe	
1-122	H	4-Cl	N	OMe	OMe	
1-123	H	4-Me	N	OMe	OMe	
1-124	H	4-CF ₃	N	OMe	OMe	
1-125	H	4-OMe	N	OMe	OMe	

(表40)

化合物 番号	X	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-126	H	4-NO ₂	N	OMe	OMe	
1-127	H	4-CO ₂ Et	N	OMe	OMe	
1-128	H	4-COPh	N	OMe	OMe	
1-129	H	3-Me	N	OMe	OMe	
1-130	H	3-Cl	N	OMe	OMe	
1-131	H	4,5-Cl ₂	N	OMe	OMe	
1-132	H	4,5-Me ₂	N	OMe	OMe	
1-133	H	4,5-(OMe) ₂	N	OMe	OMe	
1-134	H	4-CF ₃ ,6-Br	N	OMe	OMe	
1-135	H	4-CF ₃ ,6-Cl	N	OMe	OMe	
1-136	H	4,5,6-F ₃	N	OMe	OMe	
1-137	Me	6-Me	CH	OMe	OMe	
1-138	Me	6-Cl	CH	OMe	OMe	
1-139	Me	6-F	CH	OMe	OMe	
1-140	Me	5-Cl	CH	OMe	OMe	
1-141	Me	5-Br	CH	OMe	OMe	
1-142	Me	5-Me	CH	OMe	OMe	
1-143	Me	5-Bu-t	CH	OMe	OMe	
1-144	Me	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
1-145	Me	5-OMe	CH	OMe	OMe	
1-146	Me	5-COPh	CH	OMe	OMe	
1-147	Me	5-Ph	CH	OMe	OMe	
1-148	Me	5-NH ₂	CH	OMe	OMe	
1-149	Me	5-NMe ₂	CH	OMe	OMe	
1-150	Me	5-CN	CH	OMe	OMe	
1-151	Me	4-F	CH	OMe	OMe	
1-152	Me	4-Cl	CH	OMe	OMe	
1-153	Me	4-Me	CH	OMe	OMe	
1-154	Me	4-CF ₃	CH	OMe	OMe	
1-155	Me	4-OMe	CH	OMe	OMe	
1-156	Me	4-COPh	CH	OMe	OMe	
1-157	Me	4,5-Cl ₂	CH	OMe	OMe	
1-158	Me	4,5-Me ₂	CH	OMe	OMe	

(表41)

化合物 番号	X	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-159	Me	4,5-(OMe) ₂	CH	OMe	OMe	180-183
1-160	Me	6-Me	N	OMe	OMe	
1-161	Me	6-Cl	N	OMe	OMe	
1-162	Me	5-F	N	OMe	OMe	
1-163	Me	5-Cl	N	OMe	OMe	
1-164	Me	5-Br	N	OMe	OMe	
1-165	Me	5-Me	N	OMe	OMe	
1-166	Me	5-Et	N	OMe	OMe	
1-167	Me	5-Pr	N	OMe	OMe	
1-168	Me	5-Pr-i	N	OMe	OMe	
1-169	Me	5-Bu-t	N	OMe	OMe	
1-170	Me	5-CH=CH ₂	N	OMe	OMe	
1-171	Me	5-C≡CBu	N	OMe	OMe	
1-172	Me	5-CF ₃	N	OMe	OMe	
1-173	Me	5-OMe	N	OMe	OMe	
1-174	Me	5-SMe	N	OMe	OMe	
1-175	Me	5-COPh	N	OMe	OMe	
1-176	Me	5-Ph	N	OMe	OMe	
1-177	Me	5-NH ₂	N	OMe	OMe	
1-178	Me	5-NMe ₂	N	OMe	OMe	
1-179	Me	5-CN	N	OMe	OMe	
1-180	Me	4-F	N	OMe	OMe	
1-181	Me	4-Cl	N	OMe	OMe	
1-182	Me	4-Me	N	OMe	OMe	
1-183	Me	4-CF ₃	N	OMe	OMe	
1-184	Me	4-OMe	N	OMe	OMe	
1-185	Me	4-OEt	N	OMe	OMe	
1-186	Me	4-OPr	N	OMe	OMe	
1-187	Me	4-CO ₂ Et	N	OMe	OMe	
1-188	Me	4-COPh	N	OMe	OMe	
1-189	Me	4,5-Cl ₂	N	OMe	OMe	
1-190	Me	4,6-Me ₂	N	OMe	OMe	
1-191	Me	4,5-Me ₂	N	OMe	OMe	

(表 42)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-192	Me	4,5-(OMe) ₂	N	OMe	OMe	158-160
1-193	CF ₃	5-F	CH	OMe	OMe	
1-194	CF ₃	5-Cl	CH	OMe	OMe	
1-195	CF ₃	5-Br	CH	OMe	OMe	150-151
1-196	CF ₃	5-Me	CH	OMe	OMe	
1-197	CF ₃	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
1-198	CF ₃	5-OMe	CH	OMe	OMe	144-147
1-199	CF ₃	5-OEt	CH	OMe	OMe	
1-200	CF ₃	5-OPr	CH	OMe	OMe	
1-201	CF ₃	5-NMe ₂	CH	OMe	OMe	168-171
1-202	CF ₃	5-CN	CH	OMe	OMe	
1-203	CF ₃	4-F	CH	OMe	OMe	
1-204	CF ₃	4-Cl	CH	OMe	OMe	122-125
1-205	CF ₃	4-Me	CH	OMe	OMe	
1-206	CF ₃	4,5-(OMe) ₂	CH	OMe	OMe	
1-207	CF ₃	5-F	N	OMe	OMe	202-205
1-208	CF ₃	5-Cl	N	OMe	OMe	
1-209	CF ₃	5-Br	N	OMe	OMe	
1-210	CF ₃	5-Me	N	OMe	OMe	195-198
1-211	CF ₃	5-Et	N	OMe	OMe	
1-212	CF ₃	5-Pr	N	OMe	OMe	
1-213	CF ₃	5-Pr-i	N	OMe	OMe	182-185
1-214	CF ₃	5-Bu-t	N	OMe	OMe	
1-215	CF ₃	5-CF ₃	N	OMe	OMe	
1-216	CF ₃	5-OMe	N	OMe	OMe	141-144
1-217	CF ₃	5-OEt	N	OMe	OMe	
1-218	CF ₃	5-OPr	N	OMe	OMe	
1-219	CF ₃	5-OCF ₃	N	OMe	OMe	193-196
1-220	CF ₃	5-SMe	N	OMe	OMe	
1-221	CF ₃	5-NHMe	N	OMe	OMe	
1-222	CF ₃	5-NMe ₂	N	OMe	OMe	215-218
1-223	CF ₃	5-CN	N	OMe	OMe	
1-224	CF ₃	5-CO ₂ Me	N	OMe	OMe	
						183-185
						188-191
						186-189

(表43)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-225	CF ₃	5-I	N	OMe	OMe	169-172
1-226	CF ₃	4-F	N	OMe	OMe	
1-227	CF ₃	4-Cl	N	OMe	OMe	
1-228	CF ₃	6-Me	N	OMe	OMe	
1-229	CF ₃	4,5-(OMe) ₂	N	OMe	OMe	
1-230	Et	5-F	CH	OMe	OMe	
1-231	Et	5-Cl	CH	OMe	OMe	
1-232	Et	5-Me	CH	OMe	OMe	
1-233	Et	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
1-234	Et	5-OMe	CH	OMe	OMe	
1-235	Et	5-CN	CH	OMe	OMe	
1-236	Et	4-F	CH	OMe	OMe	
1-237	Et	4-Cl	CH	OMe	OMe	
1-238	Et	4-Me	CH	OMe	OMe	
1-239	Et	4,5-(OMe) ₂	CH	OMe	OMe	
1-240	Et	5-F	N	OMe	OMe	
1-241	Et	5-Cl	N	OMe	OMe	
1-242	Et	5-Me	N	OMe	OMe	
1-243	Et	5-CF ₃	N	OMe	OMe	
1-244	Et	5-OMe	N	OMe	OMe	
1-245	Et	5-CN	N	OMe	OMe	
1-246	Et	4-F	N	OMe	OMe	137-140
1-247	Et	4-Cl	N	OMe	OMe	
1-248	Et	4-Me	N	OMe	OMe	
1-249	Et	4,5-(OMe) ₂	N	OMe	OMe	
1-250	Pr	5-Cl	N	OMe	OMe	149-152
1-251	Pr-i	5-Cl	N	OMe	OMe	
1-252	Pr-c	5-Cl	N	OMe	OMe	181-184
1-253	CH ₂ OMe	5-Cl	N	OMe	OMe	
1-254	Ph	5-Cl	N	OMe	OMe	176-179
1-255	Ph	5-Br	N	OMe	OMe	
1-256	Ph(4-Cl)	5-Cl	N	OMe	OMe	
1-257	Ph(4-Me)	5-Cl	N	OMe	OMe	

(表44)

化合物 番号	X	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-258	Ph(4-OMe)	5-Cl	N	OMe	OMe	187-200 183-186
1-259	Bn	5-Cl	N	OMe	OMe	
1-260	CF ₂ Cl	5-Me	N	OMe	OMe	
1-261	CF ₂ Cl	5-Cl	N	OMe	OMe	
1-262	CF ₂ Cl	5-Br	N	OMe	OMe	
1-263	CF ₂ Cl	5-OMe	N	OMe	OMe	
1-264	CH ₂ Cl	5-Me	N	OMe	OMe	
1-265	CH ₂ Cl	5-Cl	N	OMe	OMe	
1-266	CH ₂ Cl	5-Br	N	OMe	OMe	
1-267	CH ₂ Cl	5-OMe	N	OMe	OMe	
1-268	C ₂ F ₅	5-Me	N	OMe	OMe	
1-269	C ₂ F ₅	5-Cl	N	OMe	OMe	
1-270	C ₂ F ₅	5-Br	N	OMe	OMe	
1-271	C ₂ F ₅	5-OMe	N	OMe	OMe	
1-272	Ph(4-Cl)	5-OMe	CH	OMe	OMe	
1-273	CH ₂ OMe	5-Cl	N	OMe	OMe	
1-274	CF ₃	5-Me	N	OMe	OEt	
1-275	CF ₃	5-Cl	N	OMe	OEt	
1-276	CF ₃	5-Br	N	OMe	OEt	
1-277	CF ₂ Cl	5-Cl	N	OMe	OEt	
1-278	CF ₂ Cl	5-Br	N	OMe	OEt	
1-279	CF ₂ Cl	5-Me	N	OMe	OEt	
1-280	CH ₂ Cl	5-Cl	N	OMe	OEt	
1-281	CH ₂ Cl	5-Br	N	OMe	OEt	
1-282	CH ₂ Cl	5-Me	N	OMe	OEt	
1-283	C ₂ F ₅	5-Cl	N	OMe	OEt	
1-284	C ₂ F ₅	5-Br	N	OMe	OEt	
1-285	C ₂ F ₅	5-Me	N	OMe	OEt	
1-286	Me	5-F	CH	OEt	OEt	
1-287	Me	5-Cl	CH	OEt	OEt	
1-288	Me	5-Br	CH	OEt	OEt	
1-289	Me	5-Me	CH	OEt	OEt	
1-290	Me	5-CF ₃	CH	OEt	OEt	

(表45)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-291	Me	5-F	N	OEt	OEt	159-161 194-197 191-194 201-204
1-292	Me	5-Cl	N	OEt	OEt	
1-293	Me	5-Br	N	OEt	OEt	
1-294	Me	5-Me	N	OEt	OEt	
1-295	Me	5-CF ₃	N	OEt	OEt	
1-296	CF ₃	5-F	CH	OEt	OEt	
1-297	CF ₃	5-Cl	CH	OEt	OEt	
1-298	CF ₃	5-Br	CH	OEt	OEt	
1-299	CF ₃	5-Me	CH	OEt	OEt	
1-300	CF ₃	5-CF ₃	CH	OEt	OEt	
1-301	CF ₃	5-OMe	N	OEt	OEt	
1-302	CF ₃	5-Cl	N	OEt	OEt	
1-303	CF ₃	5-Br	N	OEt	OEt	
1-304	CF ₃	5-Me	N	OEt	OEt	
1-305	CF ₃	5-CF ₃	N	OEt	OEt	
1-306	Ph	H	N	OEt	OEt	
1-307	Ph(4-Cl)	H	N	OEt	OEt	
1-308	Ph(4-Me)	H	N	OEt	OEt	
1-309	Ph(4-OMe)	H	N	OEt	OEt	
1-310	Ph	5-Cl	N	OEt	OEt	
1-311	Ph(4-Cl)	5-Cl	N	OEt	OEt	
1-312	Ph(4-Me)	5-Cl	N	OEt	OEt	
1-313	Ph(4-OMe)	5-Cl	N	OEt	OEt	
1-314	Ph	5-Br	N	OEt	OEt	150-153
1-315	Ph(4-Cl)	5-Br	N	OEt	OEt	
1-316	Ph(4-Me)	5-Br	N	OEt	OEt	
1-317	Ph(4-OMe)	5-Br	N	OEt	OEt	
1-318	H	H	CH	OPr	OPr	
1-319	Me	5-Cl	N	OPr	OPr	
1-320	Me	5-Br	N	OPr	OPr	
1-321	Me	5-Me	N	OPr	OPr	
1-322	CF ₃	5-Cl	N	OPr	OPr	
1-323	CF ₃	5-Br	N	OPr	OPr	

(表46)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-324	CF ₃	5-Me	N	OPr	OPr	198-201
1-325	H	H	CH	OPr-i	OPr-i	
1-326	Me	5-Cl	CH	OPr-i	OPr-i	
1-327	Me	5-Me	CH	OPr-i	OPr-i	
1-328	Me	5-Cl	N	OPr-i	OPr-i	
1-329	Me	5-Br	N	OPr-i	OPr-i	
1-330	Me	5-Me	N	OPr-i	OPr-i	
1-331	CF ₃	5-Cl	N	OPr-i	OPr-i	
1-332	CF ₃	5-Br	N	OPr-i	OPr-i	
1-333	CF ₃	5-Me	N	OPr-i	OPr-i	
1-334	Me	5-Cl	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	121-124
1-335	Me	5-Br	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
1-336	Me	5-Me	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
1-337	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
1-338	CF ₃	5-Br	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
1-339	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
1-340	Me	5-Cl	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
1-341	Me	5-Br	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
1-342	Me	5-Me	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
1-343	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
1-344	CF ₃	5-Br	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
1-345	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
1-346	Me	5-Cl	CH	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
1-347	Me	5-Me	CH	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
1-348	Me	5-Cl	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
1-349	Me	5-Br	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
1-350	Me	5-Me	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
1-351	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
1-352	CF ₃	5-Br	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
1-353	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
1-354	Me	5-Cl	CH	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
1-355	Me	5-Me	CH	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
1-356	H	5-Br	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	

(表47)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-357	Me	5-Cl	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
1-358	Me	5-Br	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
1-359	Me	5-Me	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
1-360	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
1-361	CF ₃	5-Br	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
1-362	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
1-363	H	5-Br	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
1-364	Me	5-Cl	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
1-365	Me	5-Br	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
1-366	Me	5-Me	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
1-367	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
1-368	CF ₃	5-Br	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
1-369	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
1-370	H	H	CH	OBn	OBn	
1-371	H	H	N	OBn	OBn	
1-372	H	H	N	OBn(4-Cl)	OBn(4-Cl)	
1-373	H	H	N	OBn(4-Me)	OBn(4-Me)	
1-374	H	H	N	OBn(4-OMe)	OBn(4-OMe)	
1-375	H	H	CH	OMe	OPh	
1-376	H	H	N	OMe	OPh	
1-377	H	H	N	OMe	OPh(4-Cl)	
1-378	H	H	N	OMe	OPh(4-Me)	
1-379	H	H	N	OMe	OPh(4-OMe)	
1-380	H	H	CH	OMe	OCHF ₂	
1-381	H	H	N	OMe	OCHF ₂	
1-382	Me	5-Cl	CH	OMe	H	
1-383	Me	5-Me	CH	OMe	H	
1-384	Me	5-CF ₃	CH	OMe	H	
1-385	Me	5-OMe	CH	OMe	H	
1-386	CF ₃	5-Cl	CH	OMe	H	125-128
1-387	CF ₃	5-Me	CH	OMe	H	130-133
1-388	CF ₃	5-CF ₃	CH	OMe	H	
1-389	CF ₃	5-OMe	CH	OMe	H	153-156

(表48)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-390	CF ₃	5-Cl	CH	OEt	H	125-127
1-391	CF ₃	5-Me	CH	OEt	H	
1-392	CF ₃	5-OMe	CH	OEt	H	
1-393	Me	5-Cl	CH	OMe	Me	
1-394	Me	5-Me	CH	OMe	Me	
1-395	Me	5-CF ₃	CH	OMe	Me	
1-396	CF ₃	5-Cl	CH	OMe	Me	
1-397	CF ₃	5-Me	CH	OMe	Me	
1-398	CF ₃	5-OMe	CH	OMe	Me	
1-399	Me	5-Cl	N	OMe	Me	
1-400	Me	5-Me	N	OMe	Me	192-195
1-401	Me	5-CF ₃	N	OMe	Me	
1-402	CF ₃	5-Cl	N	OMe	Me	
1-403	CF ₃	5-Me	N	OMe	Me	
1-404	CF ₃	5-OMe	N	OMe	Me	
1-405	CF ₃	5-Cl	N	OMe	Pr	149-152
1-406	CF ₃	5-Br	N	OMe	Pr	
1-407	CF ₃	5-Me	N	OMe	Pr	
1-408	CF ₃	5-Cl	N	OMe	Pr-c	
1-409	CF ₃	5-Br	N	OMe	Pr-c	
1-410	CF ₃	5-Me	N	OMe	Pr-c	103-106
1-411	CF ₃	5-Cl	N	OEt	Pr-c	
1-412	CF ₃	5-Me	N	OEt	Pr-c	
1-413	CF ₃	5-CF ₃	N	OEt	Pr-c	
1-414	Me	5-Cl	CH	OEt	Me	
1-415	Me	5-Me	CH	OEt	Me	136-139
1-416	Me	5-CF ₃	CH	OEt	Me	
1-417	Me	5-OMe	CH	OEt	Me	
1-418	CF ₃	5-Cl	CH	OEt	Me	
1-419	CF ₃	5-Me	CH	OEt	Me	
1-420	CF ₃	5-OMe	CH	OEt	Me	
1-421	Me	5-Cl	N	OEt	Me	
1-422	Me	5-Br	N	OEt	Me	

(表49)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-423	Me	5-Me	N	OEt	Me	175-178
1-424	Me	5-CF ₃	N	OEt	Me	
1-425	CF ₃	5-Cl	N	OEt	Me	
1-426	CF ₃	5-Br	N	OEt	Me	
1-427	CF ₃	5-Me	N	OEt	Me	
1-428	CF ₃	5-Cl	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
1-429	CF ₃	5-Me	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
1-430	CF ₃	5-OMe	CH	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
1-431	CF ₃	5-Cl	N	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
1-432	CF ₃	5-Me	N	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
1-433	CF ₃	5-OMe	N	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	
1-434	CF ₃	5-Me	CH	SMe	Me	196-199 157-160
1-435	CF ₃	5-Cl	CH	SMe	Me	
1-436	CF ₃	5-Me	N	SMe	Me	
1-437	CF ₃	5-Cl	N	SMe	Me	
1-438	CF ₃	5-Cl	N	OMe	Et	
1-439	CF ₃	5-Br	N	OMe	Et	
1-440	CF ₃	5-Me	N	OMe	Et	
1-441	CF ₃	5-Cl	N	OEt	Et	
1-442	CF ₃	5-Br	N	OEt	Et	
1-443	CF ₃	5-Me	N	OEt	Et	
1-444	Me	5-Cl	N	SMe	SMe	
1-445	Me	5-Br	N	SMe	SMe	
1-446	Me	5-Me	N	SMe	SMe	
1-447	CF ₃	5-Cl	N	SMe	SMe	
1-448	CF ₃	5-Br	N	SMe	SMe	
1-449	CF ₃	5-Me	N	SMe	SMe	
1-450	Me	5-Cl	N	OMe	SMe	
1-451	Me	5-Br	N	OMe	SMe	
1-452	CF ₃	5-Cl	N	OMe	SMe	
1-453	CF ₃	5-Br	N	OMe	SMe	
1-454	CF ₃	5-Me	N	OMe	SMe	
1-455	Me	5-Me	N	OMe	Ph	

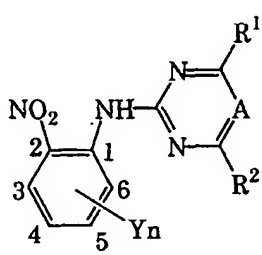
(表50)

化合物 番号	X	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-456	CF ₃	5-Me	N	OMe	Ph	219-222
1-457	Me	H	CH	Cl	Cl	
1-458	Me	4,5-Cl ₂	CH	Cl	Cl	
1-459	Me	H	N	Cl	Cl	
1-460	Me	H	CH	Cl	Me	
1-461	Me	5-Cl	N	NMe ₂	NMe ₂	
1-462	CF ₃	5-Cl	N	NMe ₂	NMe ₂	219-222
1-463	H	H	CH	OMe	NMe ₂	
1-464	H	H	CBr	OMe	OMe	
1-465	H	H	CMe	Cl	Cl	
1-466	Me	5-Me	COMe	H	H	
1-467	Me	5-Cl	COMe	H	H	
1-468	Me	5-Cl	CH	Me	Me	
1-469	Me	5-CF ₃	CH	Me	Me	
1-470	Me	5-Cl	CH	Me	CF ₃	
1-471	Me	5-Me	CH	Me	Et	
1-472	Me	5-Cl	CH	Me	Et	
1-473	CF ₃	5-Me	CH	Me	Et	
1-474	CF ₃	5-Cl	CH	Me	Et	
1-475	Me	5-Me	CH	Me	Pr-c	
1-476	Me	5-Cl	CH	Me	Pr-c	
1-477	CF ₃	5-Me	CH	Me	Pr-c	
1-478	CF ₃	5-Cl	CH	Me	Pr-c	
1-479	CF ₃	5-Cl	CH	C≡CMe	Me	
1-480	CF ₃	5-Cl	N	C≡CMe	Me	
1-481	CF ₃	5-Cl	CH	CH=CH ₂	Me	
1-482	CF ₃	5-Cl	N	CH=CH ₃	Me	
1-483	Me	5-Cl	CH	CHO	Me	
1-484	Me	5-Cl	N	CHO	Me	
1-485	Me	5-Cl	CH	COMe	Me	
1-486	Me	5-Cl	N	COMe	Me	
1-487	Me	5-Cl	CH	CH ₂ OMe	Me	
1-488	Me	5-Me	CH	CH ₂ OMe	Me	

(表51)

化合物 番号	X	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
1-489	Me	H	CH	CN	CN	
1-490	Me	H	CH	CN	Me	
1-491	Me	H	N	CN	CN	
1-492	Me	H	N	CN	Me	
1-493	Me	H	CH	SO ₂ Me	SO ₂ Me	
1-494	Me	H	N	SO ₂ Me	SO ₂ Me	
1-495	Me	H	CH	SO ₂ Me	Me	

(表52)

					
化合物 番号	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
2-1	3-Me	CH	OMe	OMe	
2-2	3-Cl	CH	OMe	OMe	
2-3	4-F	CH	OMe	OMe	194-196
2-4	4-Cl	CH	OMe	OMe	188-190
2-5	4-Br	CH	OMe	OMe	191-194
2-6	4-Me	CH	OMe	OMe	158-161
2-7	4-Bu-t	CH	OMe	OMe	
2-8	4-CF ₃	CH	OMe	OMe	178-180
2-9	4-OMe	CH	OMe	OMe	189-190
2-10	4-OEt	CH	OMe	OMe	178-180
2-11	4-OPr	CH	OMe	OMe	
2-12	4-OCF ₃	CH	OMe	OMe	144-147
2-13	4-OCH ₂ CH=CH ₂	CH	OMe	OMe	
2-14	4-OCH ₂ C≡CH	CH	OMe	OMe	
2-15	4-OPh	CH	OMe	OMe	
2-16	4-OPh(4-Cl)	CH	OMe	OMe	
2-17	4-OPh(4-Me)	CH	OMe	OMe	
2-18	4-OPh(4-OMe)	CH	OMe	OMe	
2-19	4-SMe	CH	OMe	OMe	
2-20	4-CH ₂ OMe	CH	OMe	OMe	
2-21	4-COMe	CH	OMe	OMe	
2-22	4-COPh	CH	OMe	OMe	
2-23	4-CO ₂ Et	CH	OMe	OMe	
2-24	4-Ph	CH	OMe	OMe	

(表53)

化合物 番号	Yn	A	R ¹	R ²	融点(°C) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
2-25	4-Ph(4-Cl)	CH	OMe	OMe	241-244
2-26	4-Ph(4-Me)	CH	OMe	OMe	
2-27	4-Ph(4-OMe)	CH	OMe	OMe	
2-28	4-NO ₂	CH	OMe	OMe	
2-29	4-NH ₂	CH	OMe	OMe	
2-30	4-NHMe	CH	OMe	OMe	
2-31	4-NMe ₂	CH	OMe	OMe	
2-32	4-CN	CH	OMe	OMe	
2-33	5-F	CH	OMe	OMe	
2-34	5-Cl	CH	OMe	OMe	
2-35	5-Me	CH	OMe	OMe	
2-36	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
2-37	5-OMe	CH	OMe	OMe	
2-38	5-CO ₂ Me	CH	OMe	OMe	
2-39	5-COPh	CH	OMe	OMe	
2-40	6-Me	CH	OMe	OMe	
2-41	6-Cl	CH	OMe	OMe	
2-42	4,5-Cl ₂	CH	OMe	OMe	
2-43	4,5-Me ₂	CH	OMe	OMe	
2-44	4,5-(OMe) ₂	CH	OMe	OMe	139-142
2-45	4,6-Me ₂	CH	OMe	OMe	
2-46	3-Br,5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
2-47	3-Cl,5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
2-48	3,4,5-F ₃	CH	OMe	OMe	
2-49	H	N	OMe	OMe	177-180
2-50	3-Me	N	OMe	OMe	
2-51	3-Cl	N	OMe	OMe	
2-52	4-F	N	OMe	OMe	184-187
2-53	4-Cl	N	OMe	OMe	206-208
2-54	4-Br	N	OMe	OMe	218-221
2-55	4-I	N	OMe	OMe	

(表54)

化合物 番号	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
2-56	4-Me	N	OMe	OMe	189-191
2-57	4-Et	N	OMe	OMe	146-149
2-58	4-Pr	N	OMe	OMe	170-173
2-59	4-CF ₃	N	OMe	OMe	
2-60	4-Bu-t	N	OMe	OMe	118-121
2-61	4-C≡CBu-t	N	OMe	OMe	117-120
2-62	4-OMe	N	OMe	OMe	197-199
2-63	4-OEt	N	OMe	OMe	
2-64	4-OPr	N	OMe	OMe	
2-65	4-OCF ₃	N	OMe	OMe	119-122
2-66	4-OCH ₂ CH=CH ₂	N	OMe	OMe	
2-67	4-OCH ₂ C≡CH	N	OMe	OMe	
2-68	4-OPh	N	OMe	OMe	
2-69	4-SMe	N	OMe	OMe	
2-70	4-COPh	N	OMe	OMe	221-224
2-71	4-CO ₂ Me	N	OMe	OMe	289-292
2-72	4-Ph	N	OMe	OMe	
2-73	4-Ph(4-Cl)	N	OMe	OMe	
2-74	4-Ph(4-Me)	N	OMe	OMe	
2-75	4-Ph(4-OMe)	N	OMe	OMe	
2-76	4-NO ₂	N	OMe	OMe	
2-77	4-NH ₂	N	OMe	OMe	
2-78	4-NHMe	N	OMe	OMe	
2-79	4-NMe ₂	N	OMe	OMe	155-158
2-80	4-CN	N	OMe	OMe	189-201
2-81	5-F	N	OMe	OMe	
2-82	5-Cl	N	OMe	OMe	
2-83	5-Me	N	OMe	OMe	151-154
2-84	5-CF ₃	N	OMe	OMe	
2-85	5-OMe	N	OMe	OMe	
2-86	5-NO ₂	N	OMe	OMe	

(表55)

化合物 番号	Yn	A	R ¹	R ²	融点(°C) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
2-87	5-CO ₂ Et	N	OMe	OMe	
2-88	5-COPh	N	OMe	OMe	
2-89	6-Me	N	OMe	OMe	
2-90	6-Cl	N	OMe	OMe	
2-91	4,5-Cl ₂	N	OMe	OMe	
2-92	4,5-Me ₂	N	OMe	OMe	
2-93	4,5-(OMe) ₂	N	OMe	OMe	
2-94	3-Br,5-CF ₃	N	OMe	OMe	
2-95	3-Cl,5-CF ₃	N	OMe	OMe	
2-96	3,4,5-F ₃	N	OMe	OMe	
2-97	4-Me	N	OMe	OEt	173-175
2-98	4-Cl	N	OMe	OEt	130-132
2-99	4-Br	N	OMe	OEt	
2-100	H	CH	OEt	OEt	92-95
2-101	4-F	CH	OEt	OEt	131-134
2-102	4-Cl	CH	OEt	OEt	147-149
2-103	4-Br	CH	OEt	OEt	
2-104	4-Me	CH	OEt	OEt	147-150
2-105	4-CF ₃	CH	OEt	OEt	134-137
2-106	4-F	N	OEt	OEt	
2-107	4-Cl	N	OEt	OEt	
2-108	4-Br	N	OEt	OEt	
2-109	4-Me	N	OEt	OEt	
2-110	4-CF ₃	N	OEt	OEt	
2-111	4-Cl	N	OPr	OPr	
2-112	4-Cl	CH	OPr-i	OPr-i	
2-113	4-Me	CH	OPr-i	OPr-i	
2-114	4-Cl	N	OPr-i	OPr-i	
2-115	4-Br	N	OPr-i	OPr-i	
2-116	4-Cl	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
2-117	4-Br	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	

(表56)

化合物 番号	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
2-118	4-Cl	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	65-68
2-119	4-Br	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
2-120	4-Cl	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
2-121	4-Br	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
2-122	4-Br	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
2-123	4-Cl	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
2-124	4-Br	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
2-125	4-Cl	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
2-126	H	CH	OBn	OBn	
2-127	H	N	OBn	OBn	
2-128	H	N	OBn(4-Cl)	OBn(4-Cl)	
2-129	H	N	OBn(4-Me)	OBn(4-Me)	
2-130	H	N	OBn(4-OMe)	OBn(4-OMe)	
2-131	H	CH	OMe	OPh	
2-132	H	N	OMe	OPh	
2-133	H	N	OMe	OPh(4-Cl)	
2-134	H	N	OMe	OPh(4-Me)	
2-135	H	N	OMe	OPh(4-OMe)	
2-136	H	CH	OMe	OCHF ₂	136-139
2-137	H	N	OMe	OCHF ₂	
2-138	4-Cl	CH	OMe	H	
2-139	4-Me	CH	OMe	H	
2-140	4-Cl	CH	OEt	H	
2-141	4-Me	CH	OEt	H	
2-142	4-Cl	CH	OMe	Me	
2-143	4-Me	CH	OMe	Me	
2-144	4-CF ₃	CH	OMe	Me	
2-145	4-Cl	N	OMe	Me	155-158
2-146	4-Me	N	OMe	Me	
2-147	4-Cl	N	OMe	Pr	
2-148	4-Me	N	OMe	Pr	

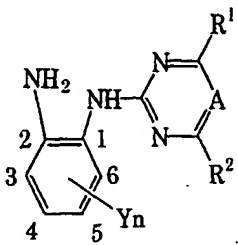
(表57)

化合物 番号	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
2-149	4-Cl	N	OMe	Pr-c	130133
2-150	4-Br	N	OMe	Pr-c	
2-151	4-Me	N	OMe	Pr-c	
2-152	4-Cl	N	OEt	Pr-c	
2-153	4-Me	N	OEt	Pr-c	
2-154	4-Cl	N	OMe	Et	109-112
2-155	4-Br	N	OMe	Et	113-116
2-156	4-Me	N	OMe	Et	75-78
2-157	4-Cl	N	OEt	Et	
2-158	4-Br	N	OEt	Et	
2-159	4-Me	N	OEt	Et	
2-160	4-Me	N	OPr	Me	
2-161	4-Cl	N	OPr	Me	175-178
2-162	4-Me	CH	Me	Et	64-67
2-163	4-Cl	CH	Me	Et	
2-164	4-Me	CH	Et	Et	
2-165	4-Cl	CH	Et	Et	
2-166	4-Me	N	Me	SMe	
2-167	4-Cl	N	SMe	SMe	174-177
2-168	4-Br	N	SMe	SMe	179-182
2-169	4-Me	N	SMe	SMe	165-168 >300
2-170	4-Cl	N	OMe	SMe	
2-171	4-Me	N	OMe	SMe	
2-172	4-Me	N	OMe	Ph	
2-173	4-Cl	N	NMe ₂	NMe ₂	
2-174	H	CBr	OMe	OMe	106-109
2-175	H	CMe	Cl	Cl	
2-176	4-Me	COMe	H	H	
2-177	4-Cl	COMe	H	H	
2-178	4-Me	N	Cl	Ph	
2-179	4-Cl	N	Cl	Ph	

(表58)

化合物 番号	Yn	A	R ¹	R ²	融点(°C) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
2-180	4-Cl	CH	C≡CMe	Me	
2-181	4-Cl	N	C≡CMe	Me	
2-182	4-Cl	CH	CH=CH ₂	Me	
2-183	4-Cl	N	CH=CH ₂	Me	
2-184	4-Cl	CH	CHO	Me	
2-185	4-Cl	N	CHO	Me	
2-186	4-Cl	CH	COMe	Me	
2-187	4-Cl	N	COMe	Me	
2-188	4-Cl	CH	CH ₂ OMe	Me	
2-189	4-Me	CH	CH ₂ OMe	Me	
2-190	H	CH	CN	CN	
2-191	H	CH	CN	Me	
2-192	H	N	CN	CN	
2-193	H	N	CN	Me	
2-194	H	CH	SO ₂ Me	SO ₂ Me	
2-195	H	N	SO ₂ Me	SO ₂ Me	
2-196	H	CH	SO ₂ Me	Me	

(表59)

					
化合物 番号	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
3-1	3-Me	CH	OMe	OMe	120-123
3-2	3-Cl	CH	OMe	OMe	
3-3	4-F	CH	OMe	OMe	
3-4	4-Cl	CH	OMe	OMe	
3-5	4-Br	CH	OMe	OMe	
3-6	4-Me	CH	OMe	OMe	
3-7	4-Bu-t	CH	OMe	OMe	
3-8	4-CF ₃	CH	OMe	OMe	
3-9	4-OMe	CH	OMe	OMe	
3-10	4-OEt	CH	OMe	OMe	
3-11	4-OPr	CH	OMe	OMe	129-132
3-12	4-OCF ₃	CH	OMe	OMe	
3-13	4-OCH ₂ CH=CH ₂	CH	OMe	OMe	
3-14	4-OCH ₂ C≡CH	CH	OMe	OMe	
3-15	4-OPh	CH	OMe	OMe	
3-16	4-OPh(4-Cl)	CH	OMe	OMe	
3-17	4-OPh(4-Me)	CH	OMe	OMe	
3-18	4-OPh(4-OMe)	CH	OMe	OMe	
3-19	4-SMe	CH	OMe	OMe	
3-20	4-CH ₂ OMe	CH	OMe	OMe	
3-21	4-COMe	CH	OMe	OMe	85-88
3-22	4-COPh	CH	OMe	OMe	
3-23	4-CO ₂ Et	CH	OMe	OMe	
3-24	4-Ph	CH	OMe	OMe	

(表60)

化合物 番号	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(°C) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
3-25	4-Ph(4-Cl)	CH	OMe	OMe	166-169
3-26	4-Ph(4-Me)	CH	OMe	OMe	
3-27	4-Ph(4-OMe)	CH	OMe	OMe	
3-28	4-NO ₂	CH	OMe	OMe	
3-29	4-NH ₂	CH	OMe	OMe	
3-30	4-NHMe	CH	OMe	OMe	
3-31	4-NMe ₂	CH	OMe	OMe	
3-32	4-CN	CH	OMe	OMe	
3-33	5-F	CH	OMe	OMe	
3-34	5-Cl	CH	OMe	OMe	
3-35	5-Me	CH	OMe	OMe	124-125 91-94
3-36	5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
3-37	5-OMe	CH	OMe	OMe	
3-38	5-CO ₂ Me	CH	OMe	OMe	
3-39	5-COPh	CH	OMe	OMe	
3-40	6-Me	CH	OMe	OMe	
3-41	6-Cl	CH	OMe	OMe	
3-42	4,5-Cl ₂	CH	OMe	OMe	
3-43	4,6-Me ₂	CH	OMe	OMe	
3-44	4,5-Me ₂	CH	OMe	OMe	145-147
3-45	4,5-(OMe) ₂	CH	OMe	OMe	
3-46	3-Br,5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
3-47	3-Cl,5-CF ₃	CH	OMe	OMe	
3-48	3,4,5-F ₃	CH	OMe	OMe	
3-49	H	N	OMe	OMe	
3-50	3-Me	N	OMe	OMe	
3-51	3-Cl	N	OMe	OMe	
3-52	4-F	N	OMe	OMe	183-186 202-205 200-203 191-194
3-53	4-Cl	N	OMe	OMe	
3-54	4-Br	N	OMe	OMe	
3-55	4-I	N	OMe	OMe	

(表61)

化合物 番号	Yn	A	R ¹	R ²	融点(°C) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
3-56	4-Me	N	OMe	OMe	180-183
3-57	4-Et	N	OMe	OMe	123-126
3-58	4-Pr	N	OMe	OMe	136-139
3-59	4-CF ₃	N	OMe	OMe	177-180
3-60	4-Bu-t	N	OMe	OMe	140-143
3-61	4-C≡CBu-t	N	OMe	OMe	161-164
3-62	4-OMe	N	OMe	OMe	182-185
3-63	4-OEt	N	OMe	OMe	
3-64	4-OPr	N	OMe	OMe	
3-65	4-OCF ₃	N	OMe	OMe	
3-66	4-OCH ₂ CH=CH ₂	N	OMe	OMe	
3-67	4-OCH ₂ C≡CH	N	OMe	OMe	
3-68	4-OPh	N	OMe	OMe	
3-69	4-SMe	N	OMe	OMe	
3-70	4-COPh	N	OMe	OMe	175-178
3-71	4-CO ₂ Me	N	OMe	OMe	197-200
3-72	4-Ph	N	OMe	OMe	
3-73	4-Ph(4-Cl)	N	OMe	OMe	
3-74	4-Ph(4-Me)	N	OMe	OMe	
3-75	4-Ph(4-OMe)	N	OMe	OMe	
3-76	4-NO ₂	N	OMe	OMe	
3-77	4-NH ₂	N	OMe	OMe	
3-78	4-NHMe	N	OMe	OMe	
3-79	4-NMe ₂	N	OMe	OMe	115-118
3-80	4-CN	N	OMe	OMe	215-218
3-81	5-F	N	OMe	OMe	
3-82	5-Cl	N	OMe	OMe	
3-83	5-Me	N	OMe	OMe	131-134
3-84	5-CF ₃	N	OMe	OMe	
3-85	5-OMe	N	OMe	OMe	
3-86	5-NO ₂	N	OMe	OMe	

(表62)

化合物 番号	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
3-87	5-CO ₂ Et	N	OMe	OMe	
3-88	5-COPh	N	OMe	OMe	
3-89	6-Me	N	OMe	OMe	
3-90	6-Cl	N	OMe	OMe	
3-91	4,5-Cl ₂	N	OMe	OMe	
3-92	4,5-Me ₂	N	OMe	OMe	
3-93	4,5-(OMe) ₂	N	OMe	OMe	
3-94	3-Br,5-CF ₃	N	OMe	OMe	
3-95	3-Cl,5-CF ₃	N	OMe	OMe	
3-96	3,4,5-F ₃	N	OMe	OMe	
3-97	4-Me	N	OMe	OEt	134-137
3-98	4-Cl	N	OMe	OEt	132-135
3-99	4-Br	N	OMe	OEt	140-142
3-100	H	CH	OEt	OEt	146-148
3-101	4-F	CH	OEt	OEt	
3-102	4-Cl	CH	OEt	OEt	
3-103	4-Br	CH	OEt	OEt	
3-104	4-Me	CH	OEt	OEt	
3-105	4-CF ₃	CH	OEt	OEt	167-170
3-106	4-F	N	OEt	OEt	
3-107	4-Cl	N	OEt	OEt	163-166
3-108	4-Br	N	OEt	OEt	172-175
3-109	4-Me	N	OEt	OEt	158-161
3-110	4-Bu-t	N	OEt	OEt	128-129
3-111	4-OMe	N	OEt	OEt	128-129
3-112	4-CF ₃	N	OEt	OEt	
3-113	4-Cl	N	OPr	OPr	145-148
3-114	4-Cl	CH	OPr-i	OPr-i	
3-115	4-Me	CH	OPr-i	OPr-i	
3-116	4-Cl	N	OPr-i	OPr-i	179-182
3-117	4-Br	N	OPr-i	OPr-i	

(表63)

化合物 番号	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
3-118	4-Cl	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	156-159
3-119	4-Br	N	OCH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂	
3-120	4-Cl	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
3-121	4-Br	N	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡CH	
3-122	4-Cl	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
3-123	4-Br	N	OCH ₂ CN	OCH ₂ CN	
3-124	4-Br	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
3-125	4-Cl	N	OCH ₂ CH ₂ OMe	OCH ₂ CH ₂ OMe	
3-126	4-Br	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
3-127	4-Cl	N	OCH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c	
3-128	H	CH	OBn	OBn	
3-129	H	N	OBn	OBn	
3-130	H	N	OBn(4-Cl)	OBn(4-Cl)	
3-131	H	N	OBn(4-Me)	OBn(4-Me)	
3-132	H	N	OBn(4-OMe)	OBn(4-OMe)	
3-133	H	CH	OMe	OPh	
3-134	H	N	OMe	OPh	
3-135	H	N	OMe	OPh(4-Cl)	
3-136	H	N	OMe	OPh(4-Me)	
3-137	H	N	OMe	OPh(4-OMe)	
3-138	H	CH	OMe	OCHF ₂	
3-139	H	N	OMe	OCHF ₂	
3-140	4-Cl	CH	OMe	H	136-139
3-141	4-Me	CH	OMe	H	126-129
3-142	4-Cl	CH	OEt	H	113-115
3-143	4-Me	CH	OEt	H	103-105
3-144	4-Cl	CH	OMe	Me	134-137
3-145	4-Me	CH	OMe	Me	
3-146	4-CF ₃	CH	OMe	Me	
3-147	4-Cl	N	OMe	Me	
3-148	4-Me	N	OMe	Me	202-205

(表64)

化合物 番号	Yn	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
3-149	4-Cl	N	OMe	Pr	133-136
3-150	4-Me	N	OMe	Pr	
3-151	4-Cl	N	OMe	Pr-c	
3-152	4-Br	N	OMe	Pr-c	163-165
3-153	4-Me	N	OMe	Pr-c	56-59
3-154	4-Cl	N	OEt	Pr-c	163-166
3-155	4-Me	N	OEt	Pr-c	105-108
3-156	4-Cl	N	OMe	Et	155-158
3-157	4-Br	N	OMe	Et	162-165
3-158	4-Me	N	OMe	Et	171-174
3-159	4-Cl	N	OEt	Et	
3-160	4-Br	N	OEt	Et	
3-161	4-Me	N	OEt	Et	
3-162	4-Me	N	OPr	Me	92-95
3-163	4-Cl	N	OPr	Me	
3-164	4-Me	CH	Me	Et	
3-165	4-Cl	CH	Me	Et	91-94
3-166	4-Me	CH	Et	Et	
3-167	4-Cl	CH	Et	Et	
3-168	4-Me	N	Me	SMe	180-183
3-169	4-Cl	N	SMe	SMe	192-195
3-170	4-Br	N	SMe	SMe	
3-171	4-Me	N	SMe	SMe	
3-172	4-Cl	N	OMe	SMe	
3-173	4-Me	N	OMe	SMe	170-173
3-174	4-Me	N	OMe	Ph	
3-175	4-Cl	N	NMe ₂	NMe ₂	
3-176	H	CBr	OMe	OMe	176-179
3-177	H	CMe	Cl	Cl	
3-178	4-Me	COMe	H	H	
3-179	4-Cl	COMe	H	H	

(表65)

化合物 番号	Y _n	A	R ¹	R ²	融点(℃) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
3-180	4-Me	N	Cl	Ph	
3-181	4-Cl	N	Cl	Ph	
3-182	4-Cl	CH	C≡CMe	Me	
3-183	4-Cl	N	C≡CMe	Me	
3-184	4-Cl	CH	CH=CH ₂	Me	
3-185	4-Cl	N	CH=CH ₂	Me	
3-186	4-Cl	CH	CHO	Me	
3-187	4-Cl	N	CHO	Me	
3-188	4-Cl	CH	COMe	Me	
3-189	4-Cl	N	COMe	Me	
3-190	4-Cl	CH	CH ₂ OMe	Me	
3-191	4-Me	CH	CH ₂ OMe	Me	
3-192	H	CH	CN	CN	
3-193	H	CH	CN	Me	
3-194	H	N	CN	CN	
3-195	H	N	CN	Me	
3-196	H	CH	SO ₂ Me	SO ₂ Me	
3-197	H	N	SO ₂ Me	SO ₂ Me	
3-198	H	CH	SO ₂ Me	Me	

発明を実施するための最良の形態

次に、実施例をあげて本発明化合物の製造法、製剤法並びに用途を具体的に説明する。

<製造例 1>

1-(4-メトキシピリミジン-2-イル)-ベンズイミダゾール(化合物番号 I-667)

ベンズイミダゾール(0.50g)をジメチルホルムアミド(10ml)に溶解し室温下にて水素化ナトリウム(60%純度、油性)(0.18g)を加えた。1時間攪拌後、2-クロロ-4-メトキシピリミジン(0.62g)を室温にて加え3時間攪拌した。氷水を加え、酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、白色粉末(融点 114-116℃)の目的物 0.40g を得た。

<製造例 2>

1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-2-メチルチオベンズイミダゾール(化合物番号 I-4)

2-メチルチオベンズイミダゾール(0.50g)をジメチルホルムアミド(10ml)に溶解し室温下にて水素化ナトリウム(60%純度、油性)(0.13g)を加えた。1時間攪拌後、2-メチルスルホニル-4,6-ジメトキシピリミジン(0.67g)を室温にて加え8時間攪拌した。氷水を加え、酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、白色粉末(融点 135-137℃)の目的物 0.80g を得た。

<製造例 3>

1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-2-メチルスルホニルベンズイミダゾール(化合物番号 I-5)

1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-2-メチルチオベンズイミダゾール(0.70g)、m-クロロ過安息香酸(1.30g)をクロロホルム(30ml)に溶解し室温で3

時間攪拌した。反応液を 5%炭酸カリウム水溶液、水で洗浄し有機溶媒層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、白色粉末(融点 114–117°C)の目的物 0.50g を得た。

<製造例 4>

1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-2-メトキシベンズイミダゾール
(化合物番号 I-18)

1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-2-メチルスルホニルベンズイミダゾール(0.40g)をテトラヒドロフラン(20ml)に溶解しナトリウムメチラート(0.50g)を氷冷下にて加え 1 時間攪拌した。氷水を加え、酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒留去後、混合物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、白色粉末(融点 121–122°C)の目的物 0.40g を得た。

<製造例 5>

1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-2,5-ジメチルベンズイミダゾール
(化合物番号 I-186)

N'-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-4-メチルベンゼン-1,2-ジアミン(2.50g)を酢酸(20ml)、無水酢酸(10ml)に溶解し 4 時間還流した。水を加え結晶を濾取し水洗後乾燥した。エタノールで再結晶し、白色羽毛状結晶(融点 163–166°C)の目的物 1.90g を得た。

<製造例 6>

2-アミノ-1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-5-メチルベンズイミダゾール(化合物番号 I-362)

N'-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-4-メチルベンゼン-1,2-ジアミン(2.00g)をエタノールに溶解し、室温にて臭化シアン(1.00g)を加え 60°Cにて 1 時間攪拌した。水を加え結晶を濾取し水洗後乾燥し、白色粉末(融点 300°C以上)の目的物 2.03g を得た。

<製造例 7>

2-クロロ-1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-5-メチルベンズイミダゾール(化合物番号 I-258)

2-アミノ-1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-5-メチルベンズイミダゾール(1.67g)、塩化銅(II)(0.94g)をアセトニトリル(30ml)に懸濁し亜硝酸-tert-ブチル(0.90g)を室温に加え 30 分還流した。水を加え、酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、白色羽毛状結晶(融点 145-148℃)の目的物 1.48g を得た。

<製造例 8>

1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-5-メチル-2-トリフルオロメチルベンズイミダゾール (化合物番号 I-298)

2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノ-5-メチルトリフルオロ酢酸アニリド(0.60g)、パラトルエンスルホン酸(0.05g)をトルエン(30ml)に溶解し 5 時間還流した。水、酢酸エチルを加え有機層を飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、白色粉末(融点 93-96℃)の目的物 0.56g を得た。

<製造例 9>

1-(4,6-ジクロロ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)-2-メチルベンズイミダゾール(化合物番号 I-1066)

2-メチルベンズイミダゾール(5.0g)をテトラヒドロフラン(50ml)に溶解し室温下にて水素化ナトリウム(60 純度、油性)(1.6g)を加えた。1 時間攪拌後、塩化シアヌル(7.0g)を室温にて加え 3 時間攪拌した。氷水を加え、酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、白色粉末(融点 300℃以上)

の目的物 2.6g を得た。

<製造例 10>

1-(4,6-ジメチルチオ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)-2-メチルベンズイミダゾール(化合物番号 I-1042)

1-(4,6-ジクロロ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)-2-メチルベンズイミダゾール(0.5g)をメタノール(10ml)に溶解し、室温にてメチルメルカプタンナトリウム塩 15%水溶液(0.25g)を加え、1時間攪拌した。反応終了後、反応液を氷水中にあげ析出した結晶を濾取し水洗後、乾燥し、白色粉末(融点 176-179℃)の目的物 0.46g を得た。

<製造例 11>

5-クロロ-1-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)-2-メチルベンズイミダゾール (化合物番号 I-215)

4-クロロ-N'-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)ベンゼン-1,2-ジアミン(0.5g)を酢酸(10ml)、無水酢酸(10ml)に溶解し4時間還流した。水を加え結晶を濾取し水洗後乾燥した。エタノールで再結晶し、白色羽毛状結晶(融点 173-176℃)の目的物 0.47 を得た。

<製造例 12>

5-クロロ-1-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)-2-メチルベンズイミダゾール (化合物番号 I-215)

2-ニトロ-4-クロロ-N-(4,6-ジメトキシト-[1,3,5]リアジン-2-イル)アニリン(0.5g)、鉄粉(0.3g)を酢酸(10ml)、無水酢酸(5ml)に溶解し4時間還流した。反応混合物を室温まで冷却し濾過した。濾液を減圧下濃縮し残渣に水を加え、結晶を濾取し水洗後乾燥した。エタノールで再結晶し、白色羽毛状結晶(融点 173-176℃)の目的物 0.39g を得た。

<製造例 13>

2-アミノ-5-クロロ-1-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)ベンズイミダゾール (化合物番号 I-368)

4-クロロ-N'-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)ベンゼン-1,2-ジアミン(1.5g)をエタノール(50ml)に溶解し、室温にて臭化シアン(0.6g)を加え 60℃にて 1 時間攪拌した。水を加え結晶を濾取し水洗後、乾燥し、桃色粉末(融点 293-296℃)の目的物 1.2g を得た。

<製造例 14>

2,5-ジクロロ-1-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)ベンズイミダゾール (化合物番号 I-277)

2-アミノ-5-クロロ-1-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)ベンズイミダゾール(1.1g)、塩化銅(II) (0.6g)をアセトニトリル(50ml)に懸濁し亜硝酸-tert-ブチル(0.5g)を室温で加え 30 分還流した。水を加え、酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、白色羽毛状結晶(融点 146-149℃)の目的物 0.5g を得た。

<製造例 15>

1-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)-5-メチル-2-トリフルオロメチルベンズイミダゾール (化合物番号 I-312)

2-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)アミノ-5-メチルトリフルオロ酢酸アニリド (1.0g)、パラトルエンスルホン酸(0.05g)をクロロベンゼン(30ml)に溶解し 5 時間還流した。水、酢酸エチルを加え有機層を飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、白色粉末(融点 137-140℃)の目的物 0.23g を得た。

次に、本発明化合物の例のうちいくつかの $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3/\text{TMS}, \delta (\text{ppm}))$ データを示す。

(表66)

化合物 番号	$^1\text{H-NMR}$ δ 値(ppm) 溶媒 CDCl_3
I-30	2.99(6H,s);4.03(6H,s);5.99(1H,s);7.03-7.09(1H,m);7.17-7.22(1H,m); 7.48-7.51(1H,m);7.84-7.85(1H,m);8.01(1H,s)
I-34	3.64(6H,s);5.92(1H,s);7.42-7.36(5H,m);7.56-7.60(2H,m); 7.58-7.88(1H,m);8.20-8.23(1H,m)
I-840	1.41(6H,d,J=6.3Hz);2.52(3H,s);2.98(3H,s);5.39-5.47(1H,m); 6.46(1H,s);7.26-7.33(2H,m);7.69-7.72(1H,m);8.25-8.28(1H,m)
I-872	1.01(3H,t,J=7.5Hz);1.49-1.57(2H,m);1.80-1.87(2H,m);2.51(3H,s); 4.50(2H,t,J=6.57Hz);6.45(1H,s);7.33-7.43(2H,m);7.82-7.85(1H,m); 8.55-8.59(1H,m);9.05(1H,s)
I-906	1.66-2.11(8H,m);2.45(3H,s);5.51-5.56(1H,m);6.36(1H,s); 7.28-7.41(2H,m);7.81-7.83(1H,m);8.45-8.52(1H,m);9.05(1H,s)
I-907	1.65-2.04(8H,m);2.51(3H,s);3.98(3H,s);5.51-5.55(1H,m);6.46(1H,s); 7.26-7.34(2H,m);7.68-7.73(1H,m);8.25-8.31(1H,m)
I-959	1.03(3H,t,J=7.41Hz);1.81-1.89(2H,m);2.76(2H,t,J=7.14Hz); 3.00(3H,s);4.08(3H,s);6.51(1H,s);7.27-7.33(2H,m);7.70-7.73(1H,m); 8.28-8.34(1H,m)
I-960	1.03(3H,t,J=7.29Hz);1.81-1.89(2H,m);2.77(2H,t,J=7.29Hz); 4.07(3H,s);6.58(1H,s);7.30-7.37(2H,m);7.71-7.74(1H,m); 8.00-8.05(1H,m)

次に本発明化合物合成中間体の製造例も示す。

<製造例 16>

N-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-4-メチル-2-ニトロアニリン(化合物番号 2-6)

N-ホルミル-4-メチル-2-ニトロアニリン(25.00g)をジメチルホルムアミド(400ml)に溶解し室温下にて水素化ナトリウム(60%純度、油性)(6.11g)を加えた。10分攪拌後、2-メチルスルホニル-4,6-ジメトキシピリミジン(30.28g)を室温にて加え3時間攪拌した。10%NaOH水溶液を加え結晶を濾取し水洗後乾燥し、黄色粉末(融点 158-161℃)の目的物 37.50g を得た。

<製造例 17>

N'-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-4-メチルベンゼン-1,2-ジアミン(化合物番号 3-6)

N-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-4-メチル-2-ニトロアニリン(37.50g)を酢酸エチル(600ml)に溶解し、10%パラジウム炭素(3.75g)を加えた。室温常圧水素雰囲気下にて4時間攪拌後濾過した。濾液の溶媒を留去し、白色粉末(融点 128-129℃)の目的物 32.70g を得た。

<製造例 18>

2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アミノ-5-メチルトリフルオロ酢酸アニリド(化合物番号 1-196)

N'-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-4-メチルベンゼン-1,2-ジアミン(0.80g)をピリジン(10ml)に溶解し氷塩冷下、無水トリフルオロ酢酸(0.97g)を加えた。1時間攪拌後、希塩酸を加え酢酸エチルにて抽出し希塩酸、飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、白色粉末(融点 144-147℃)の目的物 0.88g を得た。

<製造例 19>

N-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)-4-メチル-2-ニトロアニリン(化合物番号 2-56)

N-ホルミル-4-メチル-2-ニトロアニリン(7.2g)をテトラヒドロフラン(50ml)に溶解し室温下にて水素化ナトリウム(60%純度、油性)(2.0g)を加えた。10分攪拌後、2-クロロ-4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン(7.0g)を室温にて加え3時間攪拌した。10%水酸化ナトリウム水溶液を加え結晶を濾取し水洗後、乾燥し、黄色粉末(融点 189-191℃)の目的物 10.0g を得た。

<製造例 20>

N'-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)-4-メチルベンゼン-1,2-ジアミン(化合物番号 3-56)

N-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)-4-メチル-2-ニトロアニリン(10g)を酢酸エチル(50ml)および水(50ml)に溶解し、鉄 10g および酢酸(2ml)を加え2時間還流した。不溶物をろ過した後、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒留去後、白色粉末(融点 180-183℃)の目的物 8.8g を得た。

<製造例 21>

2-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)アミノ-5-メチルトリフルオロ酢酸アニリド(化合物番号 1-210)

N'-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)-4-メチルベンゼン-1,2-ジアミン (1.0g)をピリジン(50ml)に溶解し氷塩冷下、無水トリフルオロ酢酸(0.8g)を加えた。1時間攪拌後、希塩酸を加え酢酸エチルにて抽出し希塩酸、飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、白色粉末(融点 195-198℃)の目的物 1.3g を得た。

<製造例 22>

4-クロロ-N-(4,6-ジメトキシ-[1,3,5]トリアジン-2-イル)-2-ニトロア

ニリン(化合物番号 2-53)

4-クロロ-2-ニトロアニリン(5.0g)、炭酸水素ナトリウム(3.6g)をテトラヒドロフラン(50ml)に溶解し、塩化シアヌル(8.0g)を加え 8 時間攪拌した。反応溶液中に 28%ナトリウムメチラート(11.2g)を加え 1 時間還流した。水を加え、酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒留去後、残渣をエタノールで再結晶し、黄色粉末(融点 206-208℃)の目的物 6.3 を得た。

本発明の農園芸用殺菌剤は一般式 [I] で示されるトリアジニルベンズイミダゾール誘導体を有効成分として含有してなる。本発明化合物を農園芸用殺菌剤として使用する場合には、その目的に応じて有効成分を適当な剤型で用いることができる。通常は有効成分を不活性な液体または固体の担体で希釈し、必要に応じて界面活性剤、その他をこれに加え、粉剤、水和剤、乳剤、粒剤等の製剤形態で使用する。

好適な担体としては、例えばタルク、ベントナイト、クレー、カオリン、珪藻土、ホワイトカーボン、パーミキュライト、消石灰、珪砂、硫安、尿素等の固体担体、イソプロピルアルコール、キシレン、シクロヘキサノン、メチルナフタレン等の液体担体等があげられる。界面活性剤及び分散剤としては、例えばジナフチルメタンスルホン酸塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、ポリオキシエチレングリコールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンソルビタンモノアルキレート等があげられる。補助剤としてはカルボキシメチルセルロース等があげられる。これらの製剤を適宜な濃度に希釈して散布するか、または直接施用する。

本発明の農園芸用殺菌剤は茎葉散布、土壌施用または水面施用等により使用することができる。有効成分の配合割合は必要に応じ適宜選ばれるが、粉剤及び粒剤とする場合は 0.1 ~ 20 % (重量)、また乳剤及び水和剤とする場合は 5 ~ 80 % (重量) が適当である。

本発明の農園芸用殺菌剤の施用量は、使用される化合物の種類、対象病害、発

生傾向、被害の程度、環境条件、使用する剤型などによって変動する。例えば粉剤及び粒剤のようにそのまま使用する場合には、有効成分で10アール当り0.1g~5kg、好ましくは1g~1kgの範囲から適宜選ぶのがよい。また、乳剤及び水和剤のように液状で使用する場合には、0.1ppm~10,000ppm、好ましくは1~3,000ppmの範囲から適宜選ぶのがよい。

本発明による化合物は上記の施用形態により、藻菌類 (*Oomycetes*)、子囊菌類 (*Ascomycetes*)、不完全菌類 (*Deuteromycetes*)、及び担子菌類 (*Basidiomycetes*) に属する菌に起因する植物病を防除できる。次に具体的な菌名を非限定例としてあげる。シュウドペロノスポラ (*Pseudoperonospora*) 属、例えばキュウリべと病菌 (*Pseudoperonospora cubensis*)、エリシフェ (*Erysiphe*) 属、例えばコムギうどんこ病菌 (*Erysiphe graminis*)、ベンチュリア (*Venturia*) 属、例えばリンゴ黒星病菌 (*Venturia inaequalis*)、ピリキュラリア (*Pyricularia*) 属、例えばイネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*)、ボトリチス (*Botrytis*) 属、例えば灰色かび病菌 (*Botrytis cinerea*)、リゾクトニア (*Rhizoctonia*) 属、例えばイネ紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*)、プクシニア (*Puccinia*) 属、例えばコムギ赤さび病菌 (*Puccinia recondita*)。

さらに、本発明の化合物は必要に応じて殺虫剤、他の殺菌剤、除草剤、植物生長調節剤、肥料等と混用してもよい。次に本発明の農園芸用殺菌剤の代表的な製剤例をあげて製剤方法を具体的に説明する。以下の説明において「%」は重量百分率を示す。

製剤例1 粉剤

化合物 (I-45) 2%、珪藻土5%及びクレー93%を均一に混合粉碎して粉剤とした。

製剤例2 水和剤

化合物 (I-170) 50%、珪藻土45%、ジナフチルメタンジスルホン酸ナ

トリウム 2 % 及びリゲニンスルホン酸ナトリウム 3 % を均一に混合粉碎して水和剤とした。

製剤例 3 乳剤

化合物 (I-309) 30 %、シクロヘキサノン 20 %、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル 11 %、アルキルベンゼンスルホン酸カルシウム 4 % 及びメチルナフタレン 35 % を均一に溶解して乳剤とした。

製剤例 4 粒剤

化合物 (I-121) 5 %、ラウリルアルコール硫酸エステルナトリウム塩 2 %、リゲニンスルホン酸ナトリウム 5 %、カルボキシメチルセルロース 2 % 及びクレー 86 % を均一に混合粉碎する。この混合物に水 20 % を加えて練合し、押出式造粒機を用いて 14 ~ 32 メッシュの粒状に加工したのち、乾燥して粒剤とした。

次に本発明の農園芸用殺菌剤の奏する効果を試験例をあげて具体的に説明する。

試験例 1 コムギうどんこ病予防効果試験

9 cm × 9 cm の塩ビ製鉢に小麦種子 (品種: 農林 61 号) を 9 粒ずつ播種し、温室内で 8 日間育成させ、製剤例 2 に準じて調製した水和剤を有効成分濃度が 500 ppm になるように水で希釈し、1 鉢当たり 10 ml 散布した。風乾後、コムギうどんこ病菌 (*Erysiphe graminis*) の胞子を接種し、20 ~ 25 °C の温室内に入れた。接種 10 日後に鉢全体の第 1 葉の発病面積を調査し、表 67 の基準により評価した。結果を表 68、表 69 に示した。

(表 67)

評 価	
A	発病をみとめず
B	25 % 未満の発病面積
C	25 % 以上 50 % 未満の発病面積
D	50 % 以上の発病面積

(表68)

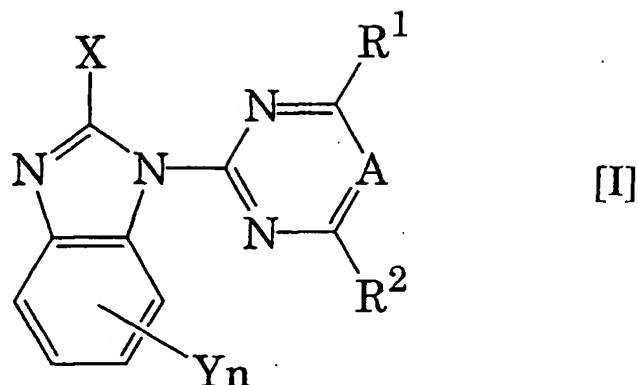
化合物番号	生物効果	化合物番号	生物効果	化合物番号	生物効果
I-1	A	I-189	A	I-307	A
I-2	A	I-192	B	I-309	A
I-3	A	I-195	B	I-310	A
I-6	B	I-199	B	I-311	A
I-7	A	I-200	A	I-312	A
I-10	B	I-201	A	I-313	A
I-22	A	I-202	B	I-314	A
I-23	A	I-203	B	I-315	B
I-25	A	I-204	A	I-316	B
I-26	A	I-208	B	I-318	A
I-27	B	I-209	B	I-321	A
I-29	B	I-212	B	I-327	A
I-30	B	I-214	A	I-332	B
I-35	B	I-215	A	I-333	A
I-38	B	I-216	A	I-334	A
I-40	B	I-217	A	I-335	A
I-41	A	I-218	A	I-336	A
I-45	A	I-219	A	I-346	A
I-66	A	I-220	B	I-358	A
I-82	A	I-221	B	I-359	A
I-83	B	I-222	B	I-360	B
I-84	A	I-225	A	I-362	A
I-85	A	I-226	A	I-364	A
I-87	A	I-229	A	I-366	A
I-88	B	I-232	B	I-368	B
I-91	B	I-234	A	I-369	B
I-111	B	I-235	A	I-375	A
I-112	B	I-239	A	I-376	B
I-113	B	I-242	A	I-377	A
I-114	B	I-250	B	I-378	A
I-116	B	I-251	A	I-379	A
I-122	B	I-255	A	I-380	A
I-130	A	I-256	A	I-381	A
I-131	A	I-258	A	I-388	A
I-132	A	I-259	A	I-389	B
I-133	A	I-260	A	I-394	A
I-134	A	I-261	B	I-400	A
I-135	A	I-263	A	I-404	B
I-136	B	I-271	A	I-405	A
I-141	A	I-272	A	I-406	A
I-175	A	I-277	B	I-423	A
I-176	A	I-279	A	I-424	A
I-181	B	I-295	A	I-438	A
I-183	B	I-296	A	I-457	B
I-184	A	I-298	A	I-458	A
I-185	A	I-299	A	I-461	A
I-186	A	I-300	A	I-462	B
I-188	A	I-301	A	I-465	B

(表69)

化合物番号	生物効果	化合物番号	生物効果	化合物番号	生物効果
I-479	A	I-752	A	I-1088	A
I-480	A	I-758	A	I-1090	B
I-482	A	I-762	A	I-1093	A
I-483	A	I-767	B	I-1094	A
I-486	A	I-768	A	I-1095	A
I-490	A	I-769	A	I-1096	A
I-498	A	I-771	A	I-1098	A
I-499	A	I-772	A	I-1103	B
I-501	A	I-775	A	I-1104	B
I-502	A	I-804	A	I-1106	B
I-503	A	I-805	B	I-1123	B
I-507	A	I-806	B	I-1147	B
I-508	B	I-809	B		
I-510	A	I-818	B		
I-511	A	I-831	B		
I-514	A	I-839	A		
I-515	A	I-840	B		
I-516	A	I-872	B		
I-530	A	I-883	A		
I-531	A	I-885	B		
I-534	A	I-894	B		
I-543	A	I-895	B		
I-544	A	I-903	B		
I-545	A	I-904	B		
I-546	A	I-915	A		
I-550	A	I-958	B		
I-573	B	I-959	A		
I-580	A	I-960	A		
I-592	A	I-962	A		
I-595	B	I-964	B		
I-601	A	I-965	A		
I-667	B	I-967	A		
I-669	B	I-999	A		
I-670	B	I-1004	A		
I-671	B	I-1019	A		
I-672	B	I-1022	A		
I-675	B	I-1043	A		
I-682	A	I-1046	A		
I-683	A	I-1048	A		
I-690	A	I-1058	A		
I-692	B	I-1059	A		
I-693	A	I-1064	B		
I-694	B	I-1071	A		
I-695	A	I-1079	B		
I-704	B	I-1082	B		
I-705	A	I-1085	A		
I-726	B	I-1086	B		
I-731	B	I-1087	A		

本発明の農園芸用殺菌剤は幅広い抗菌スペクトラムを有し、中でもコムギうどんこ病に対して卓効を示す。更に、キュウリべと病、リンゴ黒星病、イネいもち病、キュウリ灰色かび病、イネ紋枯病及びコムギ赤さび病に対して高い防除効果を有し、しかも、作物に薬害を生ずることなく、残効性、耐雨性に優れるという特徴をも併せ持っているため、農園芸用殺菌剤として有用である。

1.一般式 [I]



(式中、A は N、CR³ を示し、R¹ および R² は互いに独立して水素原子、ハロゲン原子、(C₁–C₆)アルキル基、(C₂–C₆)アルケニル基、(C₂–C₆)アルキニル基、(C₃–C₆)シクロアルキル基、(C₁–C₄)ハロアルキル基、(C₁–C₆)アルコキシ基、(C₂–C₆)アルケニルオキシ基、(C₂–C₆)アルキニルオキシ基、(C₃–C₆)シクロアルコキシ基、(C₁–C₄)ハロアルコキシ基、シアノ(C₁–C₄)アルキルオキシ基、(C₁–C₄)アルコキシ(C₁–C₄)アルキルオキシ基、(C₃–C₆)シクロアルキル(C₁–C₄)アルコキシ基、ベンジルオキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁–C₄)アルキル基又は(C₁–C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁–C₆)アルキルチオ基、(C₁–C₄)アルコキシ(C₁–C₄)アルキル基、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁–C₄)アルキル基又は(C₁–C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁–C₄)アルキルカルボニル基、ホルミル基、フェニル基、ジ(C₁–C₄)アルキルアミノ基、シアノ基、(C₁–C₆)アルキルスルホニル基を示し、R³ は水素原子、(C₁–C₆)アルキル基、(C₁–C₆)アルコキシ基、ハロゲン原子を示し、X は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁–C₆)アルキル基、(C₂–C₆)アルケニル基、(C₂–C₆)アルキニル基、(C₃–C₆)シクロアルキル基、ベンジル基 [該基はハロゲン原子、(C₁–C₄)アルキル基又は(C₁–C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁–C₆)アルコキシ基、(C₂–C₆)アルケニルオキシ基、(C₂–C₆)アルキニルオキシ基、(C₁–C₆)アルキルチオ基、(C₁–C₆)アルキルスルホニル基、フェノキシ基、(C₁–C₄)ア

ルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、(C₁-C₄)アルコキシカルボニル基、アミノ基、モノ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、アニリノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、Yはハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、(C₁-C₄)アルコキシカルボニル基、ベンゾイル基、アミノ基、モノ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、nは0又は1から3の整数を表す。} で示されるピリミジニルベンズイミダゾールおよびトリアジニルベンズイミダゾール誘導体。

2.前記一般式 [I] において A が CR³である請求項 1 記載のピリミジニルベンズイミダゾール誘導体。

3.前記一般式 [I] において A が Nである請求項 1 記載のトリアジニルベンズイミダゾール誘導体。

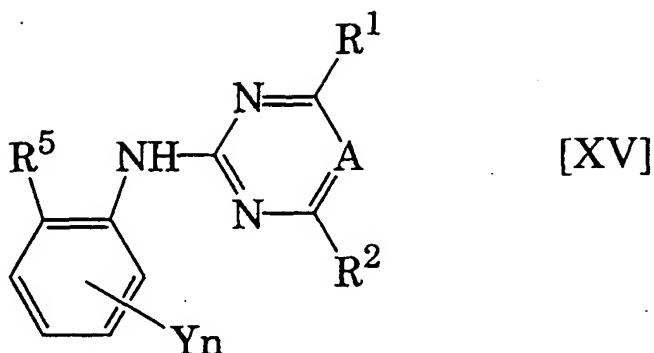
4.前記一般式 [I] において A は CR³を示し、R¹および R²は互いに独立して水素原子、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₃-C₆)シクロアルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルコキシ基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、シアノ(C₁-C₄)アルキルオキシ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルキル(C₁-C₄)アルコキシ基、ベンジルオキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、ホルミル基、フェニル基、シアノ基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基を示し、R³は

水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロゲン原子を示し、Xは水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ベンジル基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ基、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェノキシ基、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキル基、 (C_1-C_4) ハロアルキル基、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ基、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基、アミノ基、モノ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、ジ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、アニリノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]を示し、Yはハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ基、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ基、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキル基、 (C_1-C_4) ハロアルキル基、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基、ベンゾイル基、アミノ基、モノ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、ジ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]を示し、nは0又は1から3の整数を表す。}で示されるピリミジニルベンズイミダゾール誘導体。

5.前記一般式 [I] においてAはNを示し、 R^1 および R^2 は互いに独立して水素原子、ハロゲン原子、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ基、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ基、 (C_3-C_6) シクロアルコキシ基、 (C_1-C_4) ハロアルキル基、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ基、シアノ (C_1-C_4) アルキルオキシ基、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキルオキシ基、 (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_4) アルコキシ基、ベンジルオキシ基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 $(C_1$

(C_1-C_4) アルコキシ、 (C_1-C_4) アルキル基、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル基、ホルミル基、フェニル基、シアノ基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基を示し、X は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ベンジル基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ基、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェノキシ基、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキル基、 (C_1-C_4) ハロアルキル基、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ基、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基、アミノ基、モノ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、ジ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、アニリノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、Y はハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ基、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ基、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキル基、 (C_1-C_4) ハロアルキル基、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基、ベンゾイル基、アミノ基、モノ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、ジ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、n は0又は1から3の整数を表す。) で示されるトリアジニルベンズイミダゾール誘導体。

6.一般式[XV]



{式中、A は N、CR³ を示し、R¹ および R² は互いに独立して水素原子、ハロゲン原子、(C₁–C₆)アルキル基、(C₂–C₆)アルケニル基、(C₂–C₆)アルキニル基、(C₃–C₆)シクロアルキル基、(C₁–C₄)ハロアルキル基、(C₁–C₆)アルコキシ基、(C₂–C₆)アルケニルオキシ基、(C₂–C₆)アルキニルオキシ基、(C₃–C₆)シクロアルコキシ基、(C₁–C₄)ハロアルコキシ基、シアノ(C₁–C₄)アルキルオキシ基、(C₁–C₄)アルコキシ(C₁–C₄)アルキルオキシ基、(C₃–C₆)シクロアルキル(C₁–C₄)アルコキシ基、ベンジルオキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁–C₄)アルキル基又は(C₁–C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁–C₆)アルキルチオ基、(C₁–C₄)アルコキシ(C₁–C₄)アルキル基、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁–C₄)アルキル基又は(C₁–C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁–C₄)アルキルカルボニル基、ホルミル基、フェニル基、ジ(C₁–C₄)アルキルアミノ基、シアノ基、(C₁–C₆)アルキルスルホニル基を示し、R³ は水素原子、(C₁–C₆)アルキル基、(C₁–C₆)アルコキシ基、ハロゲン原子を示し、R⁵ はアミノ基、ニトロ基、–NHCOX を示し、X は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁–C₆)アルキル基、(C₂–C₆)アルケニル基、(C₂–C₆)アルキニル基、(C₃–C₆)シクロアルキル基、ベンジル基 [該基はハロゲン原子、(C₁–C₄)アルキル基又は(C₁–C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁–C₆)アルコキシ基、(C₂–C₆)アルケニルオキシ基、(C₂–C₆)アルキニルオキシ基、(C₁–C₆)アルキルチオ基、(C₁–C₆)アルキルスルホニル基、フェノキシ基、(C₁–C₄)アルコキシ(C₁–C₄)アルキル基、(C₁–C₄)ハロアルキル基、(C₁–C₄)ハロアルコキシ基、(C₁–C₄)アルキルカルボニ

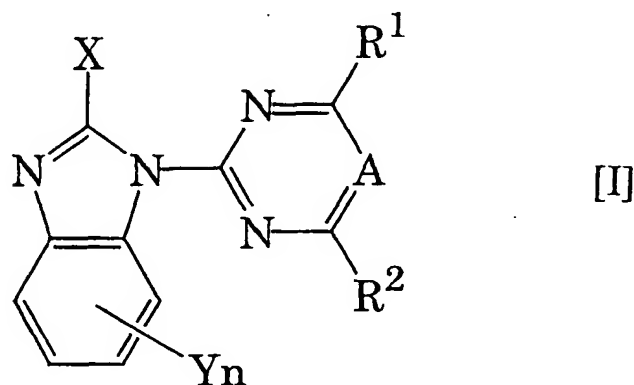
ル基、 (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基、アミノ基、モノ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、ジ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、アニリノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、Yはハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ基、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ基、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキル基、 (C_1-C_4) ハロアルキル基、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基、ベンゾイル基、アミノ基、モノ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、ジ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、nは0又は1から3の整数を表す。) で示されるアニリノピリミジン及びアニリノトリアジン誘導体。

7.請求項1、請求項2、請求項3、請求項4、請求項5記載のピリミジニルベンズイミダゾールおよびトリアジニルベンズイミダゾール誘導体を有効成分とする農園芸用殺菌剤。

補正書の請求の範囲

[2000年3月7日(07.03.00)国際事務局受理:出願当初の請求
の範囲1-7は新しい請求の範囲1-8に置き換えられた。(8頁)]

1.一般式 [I]



式中、A は N、CR³ を示し、R¹ および R² は互いに独立して水素原子、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₃-C₆)シクロアルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルコキシ基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、シアノ(C₁-C₄)アルキルオキシ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルキル(C₁-C₄)アルコキシ基、ベンジルオキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、ホルミル基、フェニル基、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、シアノ基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基を示し、R³ は水素原子、(C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロゲン原子を示し、X は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₃-C₆)シクロアルキル基、ベンジル基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、

(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェノキシ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、(C₁-C₄)アルコキシカルボニル基、アミノ基、モノ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、アニリノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、Y はハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、(C₁-C₄)アルコキシカルボニル基、ベンゾイル基、アミノ基、モノ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、n は 0 又は 1 から 3 の整数を表す。] で示されるピリミジニルベンズイミダゾールおよびトリアジニルベンズイミダゾール誘導体。

2. 前記一般式 [I] において A が CR³である請求項 1 記載のピリミジニルベンズイミダゾール誘導体。

3. 前記一般式 [I] において A が N である請求項 1 記載のトリアジニルベンズイミダゾール誘導体。

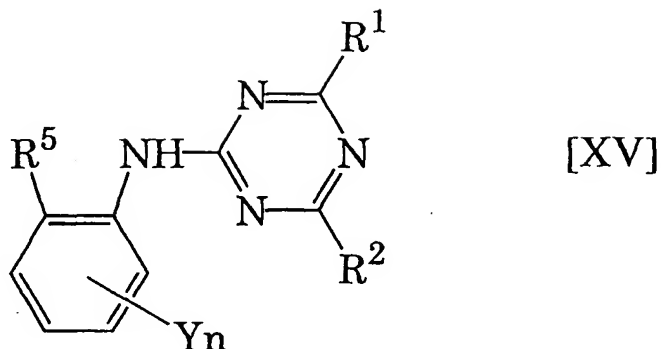
4. 前記一般式 [I] において A は CR³を示し、R¹および R²は互いに独立して水素原子、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₃-C₆)シクロアルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルコキシ基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、シアノ(C₁-C₄)アルキルオキシ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルキル(C₁-C₄)アルコキシ基、ベンジルオキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)ア

アルキル基又は(C₁—C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁—C₆)アルキルチオ基、(C₁—C₄)アルコキシ(C₁—C₄)アルキル基、(C₁—C₄)アルキルカルボニル基、ホルミル基、フェニル基、シアノ基、(C₁—C₆)アルキルスルホニル基を示し、R³は水素原子、(C₁—C₆)アルキル基、(C₁—C₆)アルコキシ基、ハロゲン原子を示し、Xは水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、(C₁—C₆)アルキル基、(C₂—C₆)アルキニル基、(C₃—C₆)シクロアルキル基、ベンジル基 [該基はハロゲン原子、(C₁—C₄)アルキル基又は(C₁—C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁—C₆)アルコキシ基、(C₂—C₆)アルケニルオキシ基、(C₂—C₆)アルキニルオキシ基、(C₁—C₆)アルキルチオ基、(C₁—C₆)アルキルスルホニル基、フェノキシ基、(C₁—C₄)アルコキシ(C₁—C₄)アルキル基、(C₁—C₄)ハロアルキル基、(C₁—C₄)ハロアルコキシ基、(C₁—C₄)アルキルカルボニル基、(C₁—C₄)アルコキシカルボニル基、アミノ基、モノ(C₁—C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁—C₄)アルキルアミノ基、アニリノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁—C₄)アルキル基又は(C₁—C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]を示し、Yはハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁—C₆)アルキル基、(C₂—C₆)アルケニル基、(C₂—C₆)アルキニル基、(C₁—C₆)アルコキシ基、(C₂—C₆)アルケニルオキシ基、(C₂—C₆)アルキニルオキシ基、(C₁—C₄)ハロアルコキシ基、(C₁—C₆)アルキルチオ基、(C₁—C₄)アルコキシ(C₁—C₄)アルキル基、(C₁—C₄)ハロアルキル基、(C₁—C₄)アルキルカルボニル基、(C₁—C₄)アルコキシカルボニル基、ベンゾイル基、アミノ基、モノ(C₁—C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁—C₄)アルキルアミノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁—C₄)アルキル基又は(C₁—C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁—C₄)アルキル基又は(C₁—C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]を示し、nは0又は1から3の整数を表す。]で示されるピリミジニルベンズイミダゾール誘導体。

5.前記一般式 [I] において A は N を示し、R¹ および R² は互いに独立して水素原子、ハロゲン原子、(C₁—C₆)アルキル基、(C₂—C₆)アルケニル基、(C₂—C₆)アルキニル基、(C₃—C₆)シクロアルキル基、(C₁—C₆)アルコキシ基、(C₂—C₆)アル

ケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルコキシ基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、シアノ(C₁-C₄)アルキルオキシ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルキル(C₁-C₄)アルコキシ基、ベンジルオキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、ホルミル基、フェニル基、シアノ基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基を示し、X は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₃-C₆)シクロアルキル基、ベンジル基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェノキシ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、(C₁-C₄)アルコキシカルボニル基、アミノ基、モノ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、アニリノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、Y はハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、(C₁-C₄)アルコキシカルボニル基、ベンゾイル基、アミノ基、モノ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、n は 0 又は 1 から 3 の整数を表す。] で示されるトリアジニルベンズイミダゾール誘導体。

6.一般式[XV]

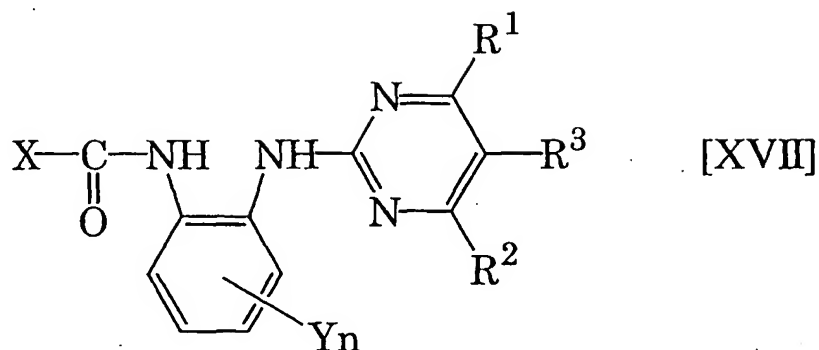


[式中、 R^1 および R^2 は互いに独立して水素原子、ハロゲン原子、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_4) ハロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ基、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ基、 (C_3-C_6) シクロアルコキシ基、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ基、シアノ (C_1-C_4) アルキルオキシ基、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキルオキシ基、 (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_4) アルコキシ基、ベンジロキシ基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキル基、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル基、ホルミル基、フェニル基、ジ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、シアノ基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基を示し、 R^3 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロゲン原子を示し、 R^5 はアミノ基、ニトロ基、 $-NHCOX$ を示し、 X は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ベンジル基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ基、

(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェノキシ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、(C₁-C₄)アルコキシカルボニル基、アミノ基、モノ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、アニリノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、Yはハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、(C₁-C₄)アルコキシカルボニル基、ベンゾイル基、アミノ基、モノ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、nは0又は1から3の整数を表す。但し、R⁵がニトロ基の場合、R¹およびR²は互いに独立して水素原子、フッ素、臭素、ヨウ素、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₃-C₆)シクロアルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₂-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルコキシ基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、シアノ(C₁-C₄)アルキルオキシ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルキル(C₁-C₄)アルコキシ基、ベンジルオキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、ホルミル基、フェニル基、シアノ基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基を示す。] で示されるアニリノトリアジ

ン誘導体。

7.一般式[XVII]



式中、 R^1 および R^2 は互いに独立して水素原子、ハロゲン原子、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_4) ハロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ基、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ基、 (C_3-C_6) シクロアルコキシ基、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ基、シアノ (C_1-C_4) アルキルオキシ基、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキルオキシ基、 (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_4) アルコキシ基、ベンジルオキシ基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキル基、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル基、ホルミル基、フェニル基、ジ (C_1-C_4) アルキルアミノ基、シアノ基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基を示し、 R^3 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロゲン原子を示し、 X は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ベンジル基 [該基はハロゲン原子、 (C_1-C_4) アルキル基又は (C_1-C_4) アルコキシ基で置換されていてもよい。]、 (C_1-C_6) アルコキシ基、

(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェノキシ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、(C₁-C₄)アルコキシカルボニル基、アミノ基、モノ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、アニリノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、Y はハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₁-C₄)ハロアルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル基、(C₁-C₄)ハロアルキル基、(C₁-C₄)アルキルカルボニル基、(C₁-C₄)アルコキシカルボニル基、ベンゾイル基、アミノ基、モノ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ基、フェニル基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。]、フェノキシ基 [該基はハロゲン原子、(C₁-C₄)アルキル基又は(C₁-C₄)アルコキシ基で置換されていてもよい。] を示し、n は 0 又は 1 から 3 の整数を表す。] で示されるアニリノピリミジン誘導体。

8. 請求項 1、請求項 2、請求項 3、請求項 4、請求項 5 記載のピリミジニルベンズイミダゾールおよびトリアジニルベンズイミダゾール誘導体を有効成分とする農園芸用殺菌剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/06364

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int.Cl ⁷ C07D403/04, 239/46, 251/42, 44, 251/46, A01N43/52, 66		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int.Cl ⁷ C07D403/04, 239/46, 251/42, 44, 251/46, A01N43/52, 66		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CA, REGISTRY (STN)		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
PX	WO, 99/05138, A1 (Zenyaku Kogyo K.K.), 04 February, 1999 (04.02.99), example 2, & AU, 9883575, A	1, 2, 4
A	US, 5179098, A (Imperial Chemical Ind. PLC), 12 January, 1993 (12.01.93), Full text & EP, 430471, A & AU, 9066531, A & US, 5314892, A & DE, 69012289, A & JP, 3-220178, A	1-7
A	US, 4698091, A (Ciba-Geigy Corporation), 12 January, 1984 (12.01.84), Full text, & EP, 96657, A & AU, 8315390, A & BR, 8303011, A & ZA, 8304117, A & ES, 8503340, A & IL, 68911, A & CA, 1237133, A & JP, 59-5169, A	1-7
PX	EP, 945443, A1 (Janssen Pharmaceutica N.V.), 29 September, 1999 (29.09.99),	6
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 06 January, 1999 (06.01.99)		Date of mailing of the international search report 18 January, 2000 (18.02.00)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office		Authorized officer
Facsimile No.		Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/06364

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
	ExampleA7& EP, 945442, A1	
X	US, 5714509, A (The University of Alavama), 03 February, 1998 (03.02.98), Table2,3,etc.& WO, 96/34603, A1&AU, 9656745, A& EP, 824349, A1&BR, 9608239, A	6
X	US, 5739129, A (Glaxo Wellcome Inc., RTP.N.C.), 14 April, 1998 (14.04.98), Intermediatell, etc.& WO, 95/28419, A1&CA, 2186900, A& AU, 9522390, A1&ZA, 9503005, A& EP, 756602, A1&HU, 76135, A& BR, 9507381, A&CN, 1176646, A& FI, 9604045, A&NO, 9604348, A	6
X	US, 4999046, A (Ciba-Geigy Corporation), 12 March, 1991 (12.03.91), Preparation Examples, etc.& EP, 337946, A1&ZA, 8902585, A& CA, 1313666, A1&AU, 8932665, A1& JP, 1-308264, A	6
X	US, 4973690, A (Ciba-Geigy Corporation), 27 November, 1990 (27.11.90), Table2, etc.& EP, 337944, A1&JP, 2-6477, A	6
X	US, 4802909, A (Ciba-Geigy Corporation), 07 February, 1989 (07.02.89), Table2& EP, 264348, A2&AU, 8779547, A& ZA, 8707641, AUS, 4904778, A	6
X	US, 4659363, A (Ciba-Geigy Corporation), 21 April, 1987 (21.04.87), Full text, & EP, 135472, A2&CA, 1218371, A& DK, 8403621, A&AU, 8430997, A& ZA, 8405705, A&ES, 534576, A& BR, 8403672, A&JP, 60-51177, A& IL, 72495, A&CA, 1218372, A	6
X	US, 4694009, A (Ciba-Geigy Corporation), 15 September, 1987 (15.09.87), Full text, & EP, 172786, A2&DK, 8502852, A& AU, 8543988, A1&ZA, 8504738, A& BR, 8503024, A&IL, 75612, A& JP, 61-15877, A	6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/06364

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DD, 151404, A (Ger. Dem. Rep.), 21 October, 1981 (21.10.81), Tabelle 1, etc. (Family: none)	6
X	JP, 56-65804, A (Ishihara Sangyo K.K.), 03 June, 1981 (03.06.81), Full text (Family: none)	6
X	Forlani Luciano, "Tautomerism of some amino aza-containing heterocycles", J. Heteocycl. Chem., (1992), 29(6), p.1461-4	6
X	Obara Yoshihiko, et al., "Studies on the biological activity of heterocyclic compounds. Part IV. On the blinding acrivities and acute oral toxicities of aminobenzenes, pyrimidines, purines, amino-s-triazines and their related compounds in baby chicks", Nippon Noge Kagaku kaishi, (1981), 55(12), P.1205-12, Table 2	6
X	Nakamura Kenji, et al., "The $N^1 \rightarrow N^2$ migration of the s-triazinyl group of 4-substituted N^1 , N^1 -bis-(s-triazinyl)-o-phenyl-ene-diamines", Bull. Chem. Soc. Jap., (1972), 45(10), P.3140-7	6
X	Chemical Abstracts, Vol.73, No.35337	6

国際調査報告

国際出願番号 PCT/J P 99/06364

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C 07 D 403/04, 239/46, 251/42, 44, 251/46, A 01 N 43/52, 66

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C 07 D 403/04, 239/46, 251/42, 44, 251/46, A 01 N 43/52, 66

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CA, REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
PX	WO, 99/05138, A1 (全薬工業株式会社), 4. 2月. 1999 (04. 02. 99), 実施例2 & AU, 9883575, A	1, 2, 4
A	US, 5179098, A (インペリアル・ケミカル・インダスト リーズ・ピーエルシー), 12. 1月. 1993 (12. 01. 9 3), 全文&EP, 430471, A&AU, 9066531, A &US, 5314892, A&DE, 69012289, A & JP, 3-220178, A	1-7

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

06. 01. 00

国際調査報告の発送日

18 January 2000 (18.01.00)

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

富永 保

印

4 P

9159

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

C (続き) 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	US, 4698091, A (チバ-ガイギー・アクチエングゼルシヤフト), 12. 1月. 1984 (12. 01. 84), 全文& EP, 96657, A&AU, 8315390, A& BR, 8303011, A&ZA, 8304117, A& ES, 8503340, A&IL, 68911, A& CA, 1237133, A&JP, 59-5169, A	1-7
PX	EP, 945443, A1 (Janssen Pharmaceutica N.V.), 29. 9月. 1999 (29. 09. 99), ExampleA7& EP, 945442, A1	6
X	US, 5714509, A (The University of Alavama), 3. 2月. 1998 (03. 02. 98), Table2,3等& WO, 96/34603, A1&AU, 9656745, A& EP, 824349, A1&BR, 9608239, A	6
X	US, 5739129, A (Glaxo Wellcome Inc., RTP.N.C.), 14. 4月. 1998 (14. 04. 98), Intermediate1等& WO, 95/28419, A1&CA, 2186900, A& AU, 9522390, A1&ZA, 9503005, A& EP, 756602, A1&HU, 76135, A& BR, 9507381, A&CN, 1176646, A& FI, 9604045, A&NO, 9604348, A	6
X	US, 4999046, A (Ciba-Geigy Corporation), 12. 3月. 1991 (12. 03. 91), Preparation Examples等& EP, 337946, A1&ZA, 8902585, A& CA, 1313666, A1&AU, 8932665, A1& JP, 1-308264, A	6
X	US, 4973690, A (Ciba-Geigy Corporation), 27. 1月. 1990 (27. 11. 90), Table2等& EP, 337944, A1&JP, 2-6477, A	6
X	US, 4802909, A (Ciba-Geigy Corporation), 7. 2月. 1989 (07. 02. 89), Table2& EP, 264348, A2&AU, 8779547, A& ZA, 8707641, AUS, 4904778, A	6
X	US, 4659363, A (Ciba-Geigy Corporation), 21. 4月. 1987 (21. 04. 87), 全文& EP, 135472, A2&CA, 1218371, A& DK, 8403621, A&AU, 8430997, A& ZA, 8405705, A&ES, 534576, A& BR, 8403672, A&JP, 60-51177, A& IL, 72495, A&CA, 1218372, A	6
X	US, 4694009, A (Ciba-Geigy Corporation), 15. 9月. 1987 (15. 09. 87), 全文& EP, 172786, A2&DK, 8502852, A& AU, 8543988, A1&ZA, 8504738, A& BR, 8503024, A&IL, 75612, A& JP, 61-15877, A	6

C (続き) 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	DD, 151404, A (Ger. Dem. Rep.), 21. 10月. 1981 (21. 10. 81), Tabelle1等 (ファミリーなし)	6
X	J P, 56-65804, A (石原産業株式会社), 3. 6月. 1981 (03. 06. 81), 全文 (ファミリーなし)	6
X	FORLANI Luciano, "Tautomerism of some amino aza-containing heterocycles", J. Heterocycl. Chem., (1992), 29(6), p. 1461-4	6
X	OBARA Yoshihiko et al., "Studies on the biological activity of heterocyclic compounds. Part IV. On the blinding activities and acute oral toxicities of aminobenzenes, pyrimidines, purines, amino-s-triazines and their related compounds in baby chicks", 日本農芸化学会誌, (1981), 55(12), p. 1205-12, Table2	6
X	NAKAMURA Kenji et al., "The N ¹ →N ² migration of the s-triazinyl group of 4-substituted N ¹ , N ¹ -bis-(s-triazinyl)-o-phenylene-diamines", Bull. Chem. Soc. Jap., (1972), 45(10), p. 3140-7	6
X	Chemical Abstracts, vol. 73, 要約番号35337	6